

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
6. September 2002 (06.09.2002)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 02/067684 A1

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: **A01N 43/54,**
43/647, 43/653, 43/707, 43/76, 43/78, 43/80, C07D
401/04, 401/14, 405/14, 409/14, 417/14, 413/14

GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR,
KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK,
MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU,
SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG,
US, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP02/01403

(22) Internationales Anmeldedatum:
11. Februar 2002 (11.02.2002)

(84) Bestimmungsstaaten (regional): ARIPO-Patent (GH,
GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW),
eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ,
TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK,
ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR),
OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW,
ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(30) Angaben zur Priorität:
101 08 481.1 22. Februar 2001 (22.02.2001) DE

Erklärung gemäß Regel 4.17:

— hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, ein Patent zu beantragen und zu erhalten (Regel 4.17 Ziffer ii) für die folgenden Bestimmungsstaaten AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW, ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG)

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): **BAYER AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE];**
51368 Leverkusen (DE).

Veröffentlicht:

— mit internationalem Recherchenbericht

(72) Erfinder; und
(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): **BRETSCHNEIDER, Thomas** [DE/DE]; Talstr. 29 b, 53797 Lohmar (DE). **ES-SAYED, Mazen** [DE/DE]; Ricarda-Huch-Str. 36, 40764 Langenfeld (DE). **FISCHER, Rüdiger** [DE/DE]; Zu den Fussfällen 23, 50259 Pulheim (DE). **MAURER, Fritz** [DE/DE]; Brahmstr. 36, 40789 Monheim (DE). **ERDELEN, Christoph** [DE/DE]; Unterbüschhof 15, 42799 Leichlingen (DE). **LÖSEL, Peter** [GB/DE]; Lohrstr. 90a, 51371 Leverkusen (DE).

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

(74) Gemeinsamer Vertreter: **BAYER AKTIENGESELLSCHAFT;** 51368 Leverkusen (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (national): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE,

WO 02/067684 A1

(54) Title: PYRIDYL PYRIMIDINES FOR USE AS PESTICIDES

(54) Bezeichnung: PYRIDYL PYRIMIDINE ALS SCHÄDLINGSBEKÄMPFUNGSMITTEL

(57) Abstract: The invention relates to novel pyridyl pyrimidines of formula (I), wherein R¹, R², X, n, Y, Z and R are defined as in the description. The invention further relates to several methods for producing said substances and to the use thereof as pesticides, as well as to novel intermediates and methods for producing the same.

(57) Zusammenfassung: Neue Pyridylpyrimidine der Formel (I) in welcher R¹, R², X, n, Y, Z und R die in der Beschreibung angegebenen Bedeutungen haben, mehrere Verfahren zur Herstellung dieser Stoffe und deren Verwendung zur Bekämpfung von Schädlingen, sowie neue Zwischenprodukte und Verfahren zu deren Herstellung.

PYRIDYL PYRIMIDINE ALS SCHÄDLINGSBEKÄMPFUNGSMITTEL

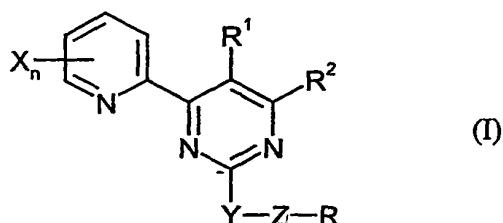
Die vorliegende Erfindung betrifft neue Pyridylpyrimidine, mehrere Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Schädlingsbekämpfungsmittel.

5

Es ist bereits bekannt, dass bestimmte Pyridylpyrimidin-Derivate pharmazeutische Wirkung besitzen (vgl. JP 52-71481). Andere Verbindungen dieses Typs sind als Zwischenprodukte zu fungiziden Wirkstoffen beschrieben (vgl. EP 0 471 261 B1). Wieder andere Derivate sind als Komplexliganden bekannt (vgl. J. Chem. Soc., Dalton Trans. 1999, 3095-3101, Tetrahedron Lett. 1999, 40, 4779-4782) oder werden 10 zur Synthese von polycyclischen Heterocyclen eingesetzt (vgl. Eur. J. Org. Chem. 1998, 2907-2912). Insektizid wirksame Pyridylpyrimidine sind bisher nicht bekannt.

Es wurden nun neue substituierte Pyridylpyrimidine der Formel (I)

15



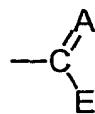
gefunden, in welcher

R¹ und R² unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyano, Alkyl, 20 Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Alkenyl, Alkinyl, Alkenyloxy, Halogenalkenyloxy, Alkinyloxy, Halogenalkinyloxy, -S(O)_pR³, -NR⁴R⁵, -COR⁶, -CO₂R⁷, -CSR⁶, -CONR⁴R⁵, -NHCO₂R⁸, Cycloalkyl; oder für gegebenenfalls substituiertes Aryl, Arylalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, 25 Sauerstoff und Schwefel stehen,

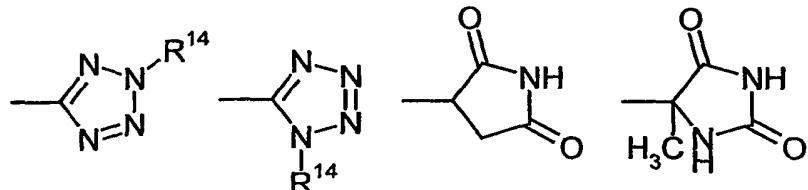
R¹ und R² außerdem gemeinsam für Alkylen oder Alkenylen stehen, wobei die Kohlenstoffkette durch 1 bis 3 Heteroatome aus der Reihe Stickstoff und Sauer-

stoff unterbrochen sein kann und der dadurch gebildete Ring wiederum gegebenenfalls durch Halogen oder Alkyl substituiert sein kann,

- X für Halogen, Nitro, Cyano, Hydroxy, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Alkenyl, Alkinyl, Alkenyloxy, Halogenalkenyloxy, Alkinyloxy, Halogenalkinyloxy, $-S(O)_pR^3$, $-NR^4R^5$, $-COR^6$, $-CO_2R^7$, $-CSR^6$, $-CONR^4R^5$, $-NHCO_2R^8$, Cycloalkyl, Aryl, Arylalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclil mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel steht;
- 10 oder wenn n für 2, 3 oder 4 steht, zwei benachbarte Reste X außerdem gemeinsam für Alkylen oder Alkenylen stehen, wobei die Kohlenstoffkette durch 1 oder 2 Heteroatome aus der Reihe Stickstoff und Sauerstoff unterbrochen sein kann,
- 15 n für 0, 1, 2, 3 oder 4 steht, wobei X für gleiche oder verschiedene Reste steht, wenn n für 2, 3 oder 4 steht,
- 20 Y für eine direkte Bindung, Sauerstoff, $-S(O)_p-$ oder $-NR^9-$ steht,
- p für 0, 1 oder 2 steht,
- Z für $-(CH_2)_r-$, $-(CH_2)_t-(CHR^{10})-(CH_2)_w-$, $-(CH_2)_r-C(O)-(CH_2)_t-$, $-(CH_2)_r-O-(CH_2)_t-$, $-(CH_2)_r-S(O)_p-(CH_2)_t-$, $-(CH_2)_r-N(R^{11})-(CH_2)_t-$ oder $-(CH_2)_t-C(R^{12})=C(R^{13})-(CH_2)_w-$ steht,
- 25 r für 1, 2, 3, 4, 5 oder 6 steht,
- t und w unabhängig voneinander für 0, 1, 2, 3 oder 4 stehen,
- 30 R für die Gruppierung



oder für ein Carbonsäurebioisoster (Säuremimic), insbesondere aus der Gruppe



5

steht,

- A für Sauerstoff, Schwefel oder NR¹⁵ steht,
- 10 E für -OR¹⁶, -SR¹⁶, -O-M, -S-M oder -NR¹⁷R¹⁸ steht,
- M für gegebenenfalls durch Alkyl, Aryl oder Arylalkyl substituiertes Ammonium oder für ein Alkalimetallion steht,
- 15 M außerdem für ein Erdalkalimetallion steht, wobei jeweils zwei Moleküle einer Verbindung ein Salz mit einem solchen Ion bilden,
- R³ für Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl; oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio substituiertes Aryl, Arylalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclylalkyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel steht,
- 20 R⁴ für Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl, Cycloalkyl oder Alkylcarbonyl steht,
- R⁵ für Wasserstoff, Amino, Formyl, Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Halogenalkyl, Cycloalkyl, Alkoxy, Alkoxyalkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl, Oxamoyl steht,

R⁴ und R⁵ außerdem gemeinsam für Alkylen; oder für gegebenenfalls durch Halogen, Nitro, Alkyl, Halogenalkyl substituiertes Benzyliden stehen;

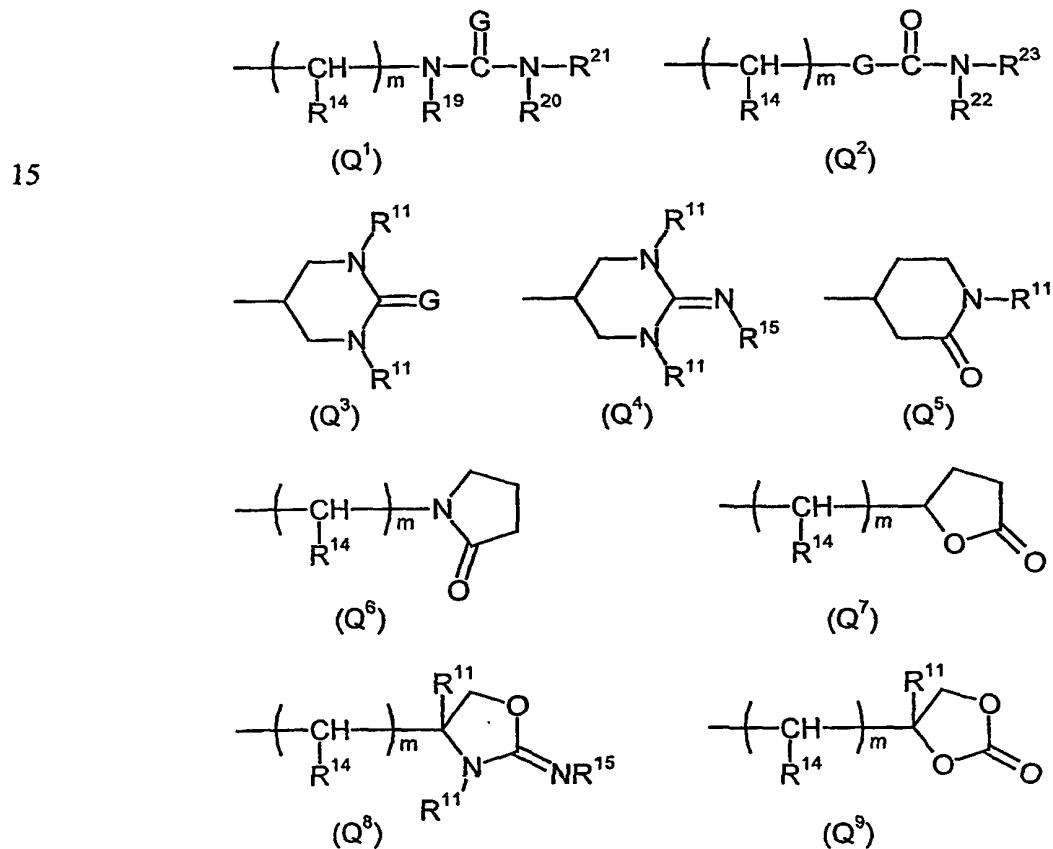
- 5 R⁴ und R⁵ außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind,
 für einen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus stehen, der gegebenenfalls ein weiteres Stickstoff-, Sauerstoff- oder Schwefelatom enthalten kann
 und der gegebenenfalls durch Alkyl substituiert sein kann,
- 10 R⁶ für Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl oder Arylalkyl steht,
- 15 R⁷ für Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl, Aryl oder
 Arylalkyl steht,
- 20 R⁸ für Alkyl oder Halogenalkyl steht,
- 25 R⁹ für Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl; oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio substituiertes Aryl, Arylalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclen oder Heterocyclalkyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel steht,
- 30 R¹⁰ für Halogen, Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy carbonyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl; oder für Aryl oder Arylalkyl, welche ihrerseits im Arylteil durch Halogen oder Alkyl substituiert sein können, steht,
- R¹¹ für Wasserstoff oder Alkyl steht,
- 35 R¹² und R¹³ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Hydroxy, Alkyl oder Alkoxy stehen,
- R¹⁴ für Wasserstoff, Alkyl oder Halogenalkyl steht,

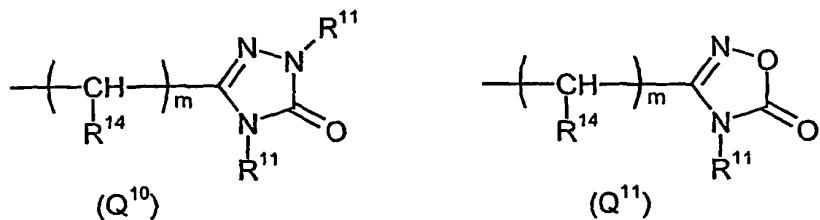
- R¹⁵ für Wasserstoff, Alkyl, Alkoxy, Cyano oder Dialkylamino steht,
- 5 R¹⁶ für Wasserstoff; für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Alkoxy-carbonyl, Alkenyloxycarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkenylcarbonyloxy, Oxy-alkylenoxy, Oxetanyl, Dioxanyl, Oxazolidinyl, Dioxolanyl, Aryloxy, Halogenaryloxy, -CONR⁴R⁵, -NR⁴R⁵, -ONR⁴R⁵, -C(R¹⁴)=N-OR¹⁴ substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl; oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Alkoxycarbonyl, Alkylcarbonyloxy substituiertes Aryl, Arylalkyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocycl oder Heterocyclalkyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel; oder für -NR⁴R⁵ oder für einen der Reste Q steht,
- 10
- 15 R¹⁶ außerdem für jeweils gegebenenfalls substituiertes Aryl, Arylalkyl, Cyclo-alkyl, Cycloalkylalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocycl oder Hete-rocyclalkyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel steht, wobei die Substituenten zusätzlich zu den oben genannten aus Hydroxy und Nitro ausgewählt werden können,
- 20
- R¹⁷ für Wasserstoff oder Alkyl steht,
- 25 R¹⁸ für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, Alkyl, Alkenyl; oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Hydroxy, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogen-alkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Oxyalkylenoxy substituiertes Cyclo-alkyl, Cycloalkylalkyl, Aryl, Arylalkyl, Heteroaryl oder Heteroarylalkyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel; oder für -S(O)_pR³, -OR¹⁴ oder -NR⁴R⁵ steht,
- 30 R¹⁸ außerdem für jeweils gleich oder verschieden durch Halogen, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Alkoxycarbonyl, Alkenyloxycarbonyl substituiertes Alkyl oder Alkenyl steht,

R¹⁸ außerdem für jeweils gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl, Aryl, Arylalkyl, Heteroaryl oder Heteroarylalkyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel steht, wobei die Substituenten zusätzlich zu den oben genannten aus Nitro und Alkoxy carbonyl ausgewählt werden können,
5

R¹⁷ und R¹⁸ außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen 5- oder 6-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus, der 1 bis 2 weitere Heteroatome aus der Reihe Stickstoff, 10 Sauerstoff und Schwefel enthalten kann und der gegebenenfalls durch Alkyl substituiert sein kann, stehen,

Q für eine der folgenden Gruppierungen





steht, wobei die Reste R¹¹ die gleiche oder verschiedene Bedeutungen haben können, wenn sie mehrfach in derselben heterocyclischen Gruppierung vorkommen,

5

- m für 0, 1, 2 oder 3 steht, wobei die Wiederholungseinheit -(CHR¹⁴)- innerhalb der Seitenkette einer heterocyclischen Gruppierung die gleiche oder verschiedene Bedeutungen haben kann, wenn m für 2 oder 3 steht,

10

- G für Sauerstoff oder Schwefel steht,

R^{19} und R^{20} unabhängig voneinander für Wasserstoff, Alkyl oder gemeinsam für Alkylen stehen,

15

- R²¹ für Wasserstoff, für gegebenenfalls durch Alkylcarbonyloxy oder Alkoxy substituiertes Alkyl; oder für gegebenenfalls durch Halogen, Cyano, Alkyl, Halogenalkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl, Alkylen substituiertes Aryl steht,

20

- R²² für Wasserstoff, Alkyl oder Alkoxyalkyl steht,

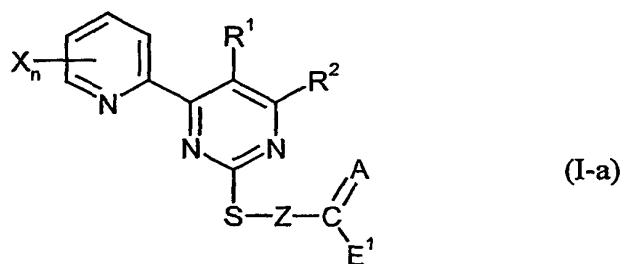
R²³ für Wasserstoff, Amino, Alkyl oder Alkoxyalkyl steht.

Die Verbindungen der Formel (I) können gegebenenfalls in Abhangigkeit von der Art und Anzahl der Substituenten als geometrische und/oder optische Isomere bzw. Regioisomere oder deren Isomerengemische in unterschiedlicher Zusammensetzung vorliegen. Sowohl die reinen Isomere als auch die Isomerengemische werden erfundungsgema beansprucht. Ebenso konnen Verbindungen der Formel (I) gegebenen-

falls in Abhängigkeit von der Art und Anzahl der Substituenten in verschiedenen tautomeren Formen vorliegen. Alle Tautomere werden erfindungsgemäß beansprucht.

5 Ebenfalls werden erfindungsgemäß alle Pyridin- und/oder Pyrimidin-N-Oxide, die durch Verbindungen der Formel (I) gebildet werden können, beansprucht. Weiterhin fallen alle Salze von Verbindungen der Formel (I), z.B. mit Mineralsäuren wie Salzsäure, unter den Anspruch der vorliegenden Erfindung.

Weiterhin wurde gefunden, dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-a)
10



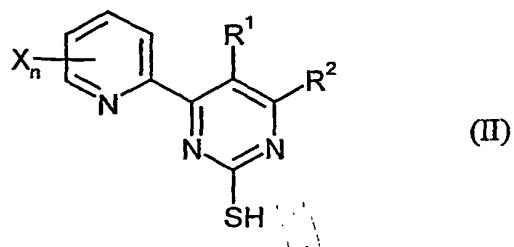
in welcher

R¹, R², X, n, Z und A die oben angegebenen Bedeutungen haben und
15

E¹ für -OR¹⁶, -SR¹⁶ oder -NR¹⁷R¹⁸ steht,

erhält, indem man

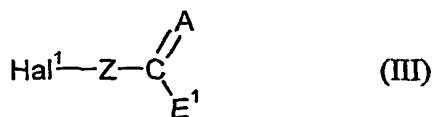
20 A) Thiole der Formel (II)



in welcher

R¹, R², X und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Halogen-Verbindungen der Formel (III)



in welcher

Z, A und E¹ die oben angegebenen Bedeutungen haben und

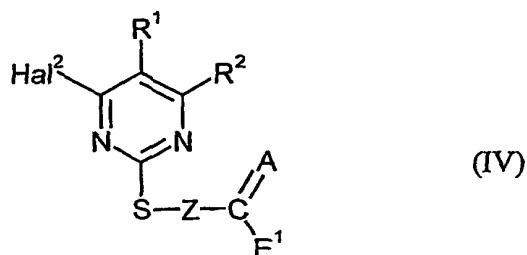
10 Hal¹ für Halogen steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in
Gegenwart eines Säurebindemittels umsetzt,

oder

15

B) Halogenpyrimidine der Formel (IV)



in welcher

20

R¹, R², Z, A und E¹ die oben angegebenen Bedeutungen haben und

Hal² für Halogen steht,

25

mit Pyridin-Verbindungen der Formel (V)

- 10 -



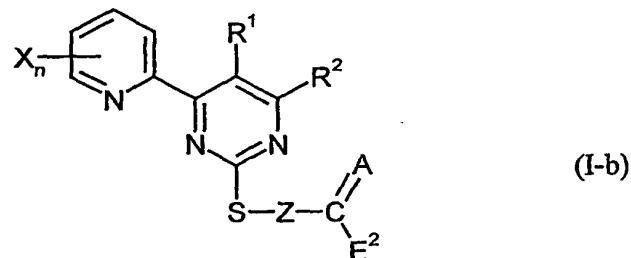
in welcher

5 X und n die oben angegebenen Bedeutungen haben und

L für Sn(Alkyl)₃, Sn(Aryl)₃, ZnBr oder ZnCl steht,10 gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und in Gegenwart
 eines Katalysators umsetzt,

oder

C) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-b)



15

in welcher

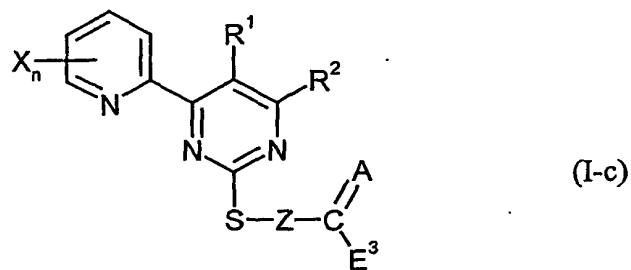
R¹, R², X, n, Z und A die oben angegebenen Bedeutungen haben und20 E² für -NR¹⁷R¹⁸ steht,

erhält, indem man

Pyridylpyrimidine der Formel (I-c)

25

- 11 -



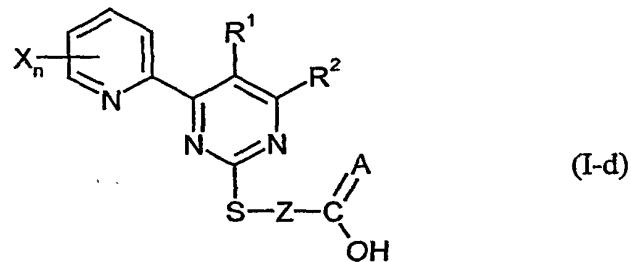
in welcher

 R^1, R^2, X, n, Z und A die oben angegebenen Bedeutungen haben und

5

 E^3 für $-OR^{16}$ steht, wobei R^{16} die oben angegebenen Bedeutungen hat,in einer ersten Stufe gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels
mit einer Base behandelt und die entstandene Verbindung der Formel (I-d)

10

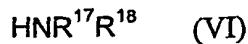


in welcher

 R^1, R^2, X, n, Z und A die oben angegebenen Bedeutungen haben,

15

in einer zweiten Stufe mit Aminen der Formel (VI)



20

in welcher

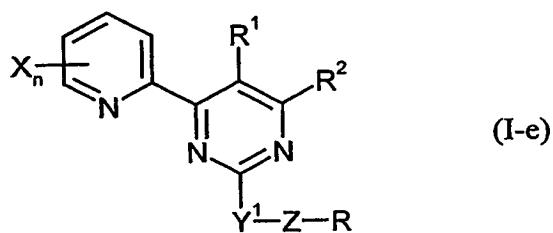
 R^{17} und R^{18} die oben angegebenen Bedeutungen haben,

- 12 -

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und in Gegenwart eines wasserabsorbierenden Reagenzes umsetzt,

5 oder

D) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-e)



10 in welcher

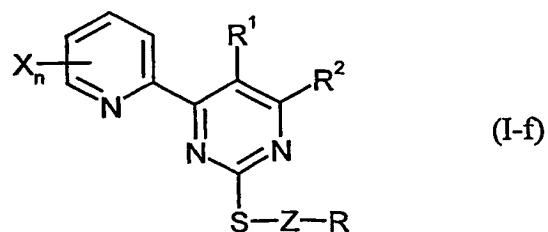
R¹, R², X, n, Z und R die oben angegebenen Bedeutungen haben und

Y¹ für -SO- oder -SO₂- steht,

15

erhält, indem man

Pyridylpyrimidine der Formel (I-f)



20

in welcher

R¹, R², X, n, Z und R die oben angegebenen Bedeutungen haben,

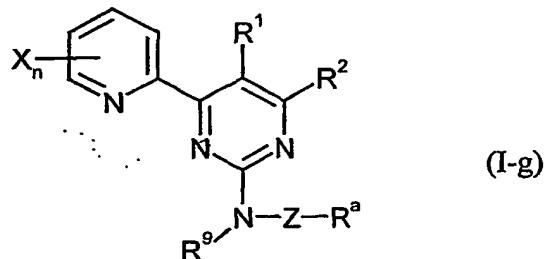
- 13 -

mit einem Oxidationsmittel gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators oxidiert,

oder

5

E) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-g)

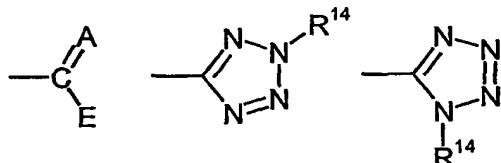


in welcher

10

R¹, R², X, n, Z und R⁹ die oben angegebenen Bedeutungen haben und

R^a für eine der folgenden Gruppierungen steht



15

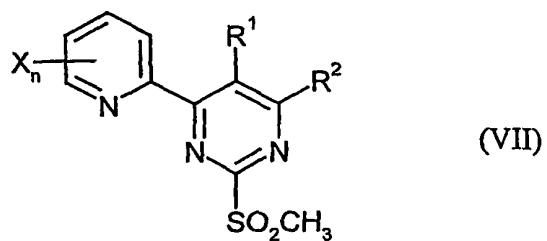
in welcher

R¹⁴ die oben angegebenen Bedeutungen hat,

20

erhält, indem man

Methylsulfonylpyrimidine der Formel (VII)



in welcher

R¹, R², X und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

5

mit Aminen der Formel (VIII)



in welcher

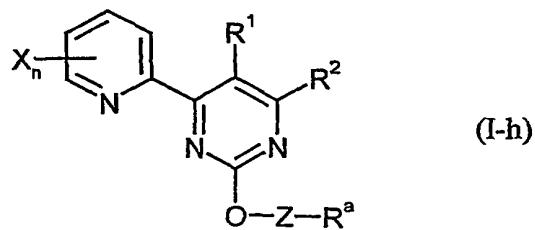
10

Z, R⁹ und R^a die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in
Gegenwart einer Base umsetzt,

15 oder

F) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-h)



20 in welcher

R¹, R², X, n, Z und R^a die oben angegebenen Bedeutungen haben,

- 15 -

erhält, indem man

Methylsulfonylpyrimidine der Formel (VII)

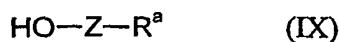


5

in welcher

R¹, R², X und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

10 mit Hydroxy-Verbindungen der Formel (IX)



in welcher

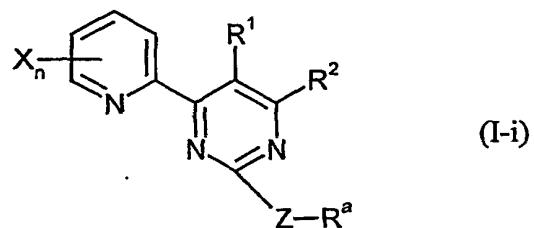
15 Z und R^a die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in
Gegenwart einer Base umsetzt,

oder

20

G) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-i)

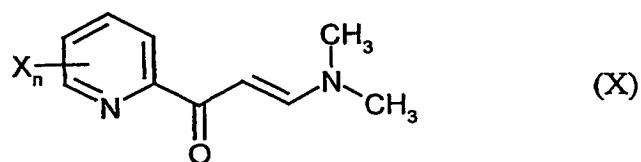


in welcher

R¹, R², X, n, Z und R^a die oben angegebenen Bedeutungen haben,

5 erhält, indem man

Pyridin-Derivate der Formel (X)

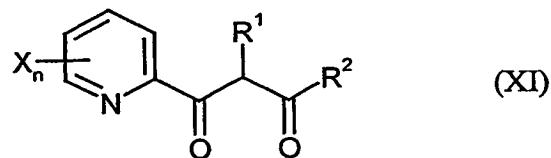


10 in welcher

X und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

oder Pyridin-Derivate der Formel (XI)

15

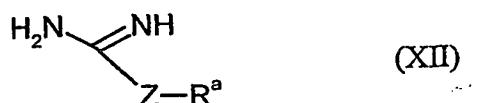


in welcher

R¹, R², X und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

20

mit Amidinen der Formel (XII)



25

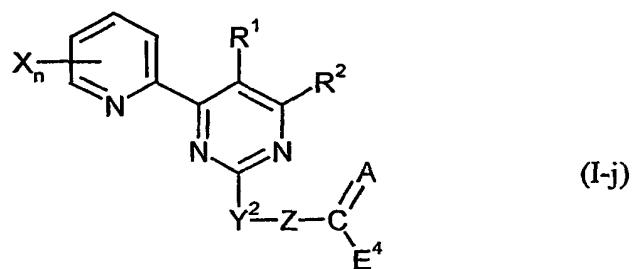
in welcher

Z und R^a die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart einer Base umsetzt,

5 oder

H) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-j)



10 in welcher

Y² für eine direkte Bindung, Sauerstoff, Schwefel oder -NR⁹- steht,

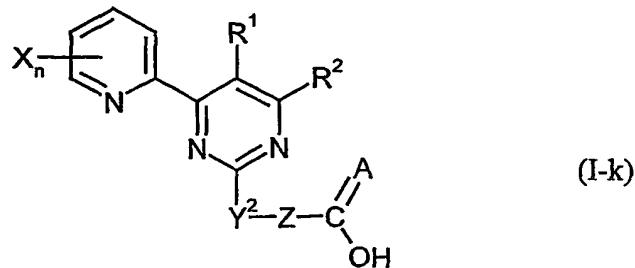
E⁴ für -O-M oder -S-M steht und

15

R¹, R², X, n, Z, A und M die oben angegebenen Bedeutungen haben,

erhält, indem man

20 Pyridylpyrimidine der Formel (I-k)



- 18 -

in welcher

R¹, R², X, n, Y², Z und A die oben angegebenen Bedeutungen haben,

5 mit Hydroxiden der Formel (XIII)



in welcher

10

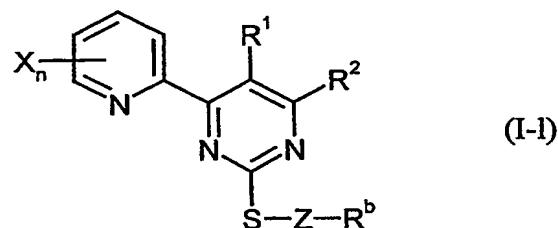
M die oben angegebenen Bedeutungen hat,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

oder

15

J) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-I)

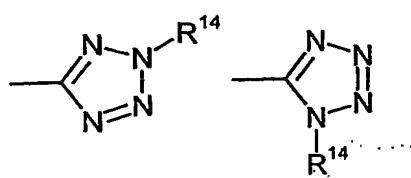


in welcher

20

R¹, R², X, n, Y und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben und

R^b für eine der folgenden Gruppierungen steht

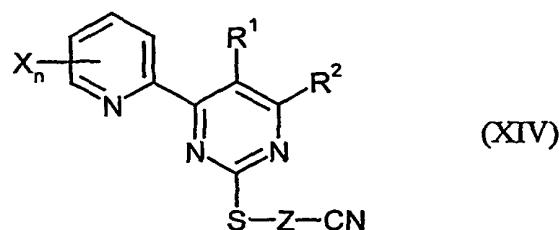


25

worin R¹⁴ die oben angegebenen Bedeutungen hat,

erhält, indem man

5 Nitrile der Formel (XIV)



in welcher

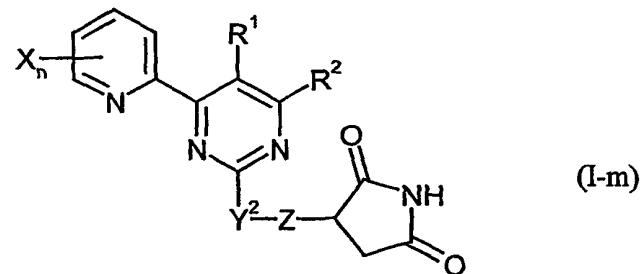
10 R¹, R², X, n und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben

mit Trialkylzinnaziden gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

oder

15

K) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-m)



in welcher

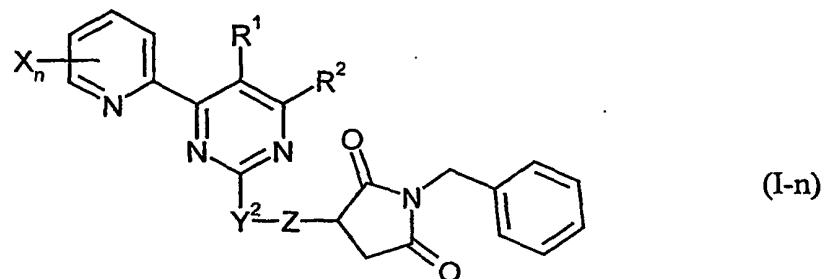
20

R¹, R², X, n, Y² und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben,

erhält, indem man

- 20 -

Pyridylpyrimidine der Formel (I-n)



in welcher

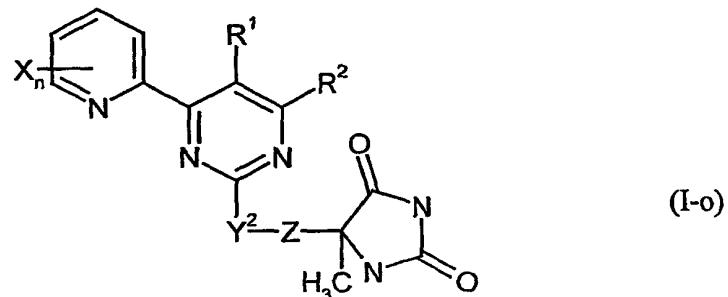
5

R¹, R², X, n, Y² und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und in Gegenwart eines Katalysators hydriert,

10 oder

L) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-o)



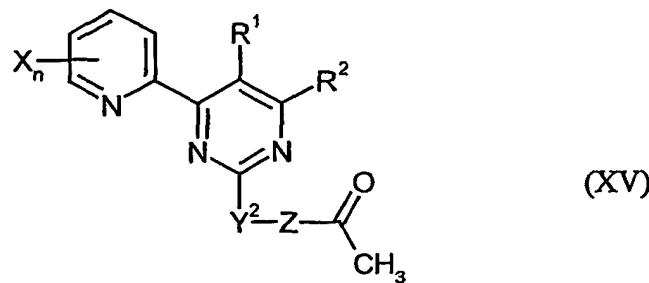
15 in welcher

R¹, R², X, n, Y² und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben,

erhält, indem man

20

Keto-Verbindungen der Formel (XV)



in welcher

- 5 R^1 , R^2 , X, n, Y^2 und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben,
mit Ammoniumcarbonat und Kaliumcyanid gegebenenfalls in Gegenwart
eines Verdünnungsmittels umsetzt.
- 10 Schließlich wurde gefunden, dass die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel
(I) sehr gute insektizide Eigenschaften besitzen und sich sowohl im Pflanzenschutz
als auch im Materialschutz zur Bekämpfung unerwünschter Schädlinge, wie Insek-
ten, verwenden lassen. Über insektizide Wirksamkeit von Pyridylpyrimidinen ist aus
dem Stand der Technik bisher nichts bekannt.
- 15 Die erfindungsgemäßen Pyridylpyrimidine sind durch die Formel (I) allgemein de-
finiert.
- 20 R^1 und R^2 stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, Halogen,
Nitro, Cyano, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_6 -
Halogenalkoxy, C_1 - C_6 -Alkylthio, C_1 - C_6 -Halogenalkylthio, C_2 - C_6 -Alkenyl,
 C_2 - C_6 -Alkinyl, C_2 - C_6 -Alkenyloxy, C_2 - C_6 -Halogenalkenyloxy, C_2 - C_6 -Alki-
nyloxy, C_2 - C_6 -Halogenalkinyloxy, $-S(O)_pR^3$, $-NR^4R^5$, $-COR^6$, $-CO_2R^7$,
 $-CSR^6$, $-CONR^4R^5$, $-NHCO_2R^8$, C_3 - C_7 -Cycloalkyl; oder für jeweils gege-
benenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, C_1 -
 C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_6 -Halogenalkoxy substi-
tuiertes Aryl, Aryl- C_1 - C_6 -alkyl oder 5- oder 6-gliedriges, gesättigtes oder un-

gesättigtes Heterocyclyl, welches 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthält.

5 R¹ und R² stehen außerdem gemeinsam bevorzugt für C₃-C₅-Alkylen oder C₃-C₄-Alkenylen, wobei die Kohlenstoffkette durch 1 oder 2 Heteroatome, welche 0 bis 2 Stickstoffatome und/oder 0 oder 1 Sauerstoffatom sein können, unterbrochen sein kann und der dadurch gebildete Ring wiederum gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C₁-C₆-Alkyl substituiert sein kann.

10 X steht bevorzugt für Halogen, Nitro, Cyano, Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, C₂-C₆-Alkenyloxy, C₂-C₆-Halogenalkenyloxy, C₂-C₆-Alkinyloxy, C₂-C₆-Halogenalkinyloxy, 15 -S(O)_pR³, -NR⁴R⁵, -COR⁶, -CO₂R⁷, -CSR⁶, -CONR⁴R⁵, -NHCO₂R⁸, C₃-C₇-Cycloalkyl, Aryl, Aryl-C₁-C₆-alkyl, 5- oder 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes, Heterocyclyl, welches 0 bis 4 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefel-

20 atome enthält;

oder wenn n für 2 oder 3 steht, stehen zwei benachbarte Reste X außerdem gemeinsam bevorzugt für C₃-C₅-Alkylen oder C₃-C₄-Alkenylen, wobei die Kohlenstoffkette durch 1 oder 2 Heteroatome, welche 0 bis 2 Stickstoffatome und/oder 0 oder 1 Sauerstoffatom sein können, unterbrochen sein kann.

25 n steht bevorzugt für 0, 1, 2 oder 3, wobei X für gleiche oder verschiedene Reste steht, wenn n für 2 oder 3 steht.

30 Y steht bevorzugt für eine direkte Bindung, Sauerstoff, -S(O)_p- oder -NR⁹-.

p steht bevorzugt für 0, 1 oder 2.

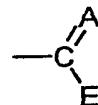
Z steht bevorzugt für $-(CH_2)_r-$, $-(CH_2)_t-(CHR^{10})-(CH_2)_w-$,
 $-(CH_2)_r-C(O)-(CH_2)_t-$, $-(CH_2)_r-O-(CH_2)_t-$, $-(CH_2)_r-S(O)_p-(CH_2)_t-$,
 $-(CH_2)_r-N(R^{11})-(CH_2)_t-$ oder $-(CH_2)_t-C(R^{12})=C(R^{13})-(CH_2)_w-$.

5

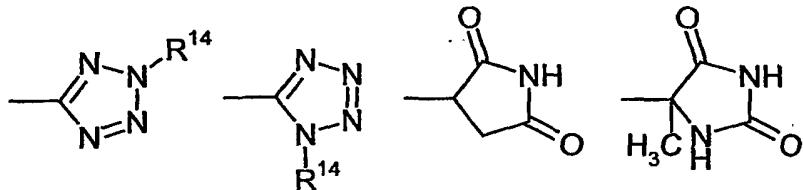
r steht bevorzugt für 1, 2, 3, 4, 5 oder 6.

t und w stehen unabhängig voneinander bevorzugt für 0, 1, 2, 3 oder 4.

10 R steht bevorzugt für die Gruppierung



15 oder für ein Carbonsäurebioisoster (Säuremimic), insbesondere aus der Gruppe



A steht bevorzugt für Sauerstoff, Schwefel oder NR¹⁵.

20

E steht bevorzugt für -OR¹⁶, -SR¹⁶, -O-M, -S-M oder -NR¹⁷R¹⁸.

25

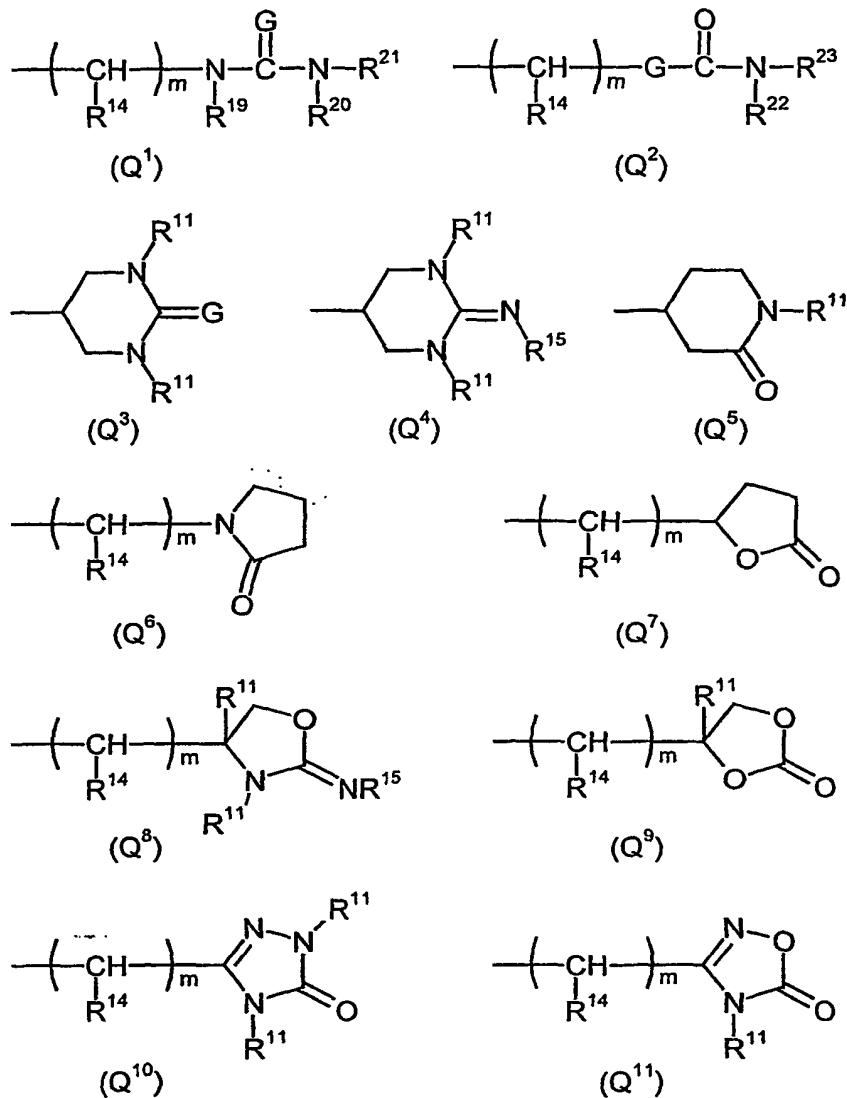
M steht bevorzugt für gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschiedenen durch C₁-C₆-Alkyl, Aryl oder Aryl-C₁-C₆-alkyl substituiertes Ammonium oder für ein Lithiumkation (Li⁺), ein Natriumkation (Na⁺) oder ein Kaliumkation (K⁺).

- M steht außerdem bevorzugt für ein Magnesiumkation (Mg^{2+}) oder ein Calciumkation (Ca^{2+}), wobei jeweils zwei Moleküle einer Verbindung ein Salz mit einem solchen Ion bilden.
- 5 R³ steht bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl-C₁-C₆-alkyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio substituiertes Aryl, Aryl-C₁-C₆-alkyl, 5- oder 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C₁-C₆-alkyl, welche jeweils 0 bis 4 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten.
- 10
- 15 R⁴ steht bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl.
- R⁵ steht bevorzugt für Wasserstoff, Amino, Formyl, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₁-C₆-Alkoxy carbonyl, Oxamoyl.
- 20
- 25 R⁴ und R⁵ stehen außerdem gemeinsam bevorzugt für C₁-C₆-Alkyldien; oder für gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Nitro, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl substituiertes Benzyliden.
- 30 R⁴ und R⁵ stehen außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, bevorzugt für einen 5- oder 6-gliedrigen, gesättigten oder ungesättigten Heterocylus, der gegebenenfalls ein weiteres Stickstoff-, Sauerstoff- oder Schwefelatom enthalten kann und der gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch C₁-C₆-Alkyl substituiert sein kann.

- R⁶ steht bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl oder Aryl-C₁-C₆-alkyl.
- 5 R⁷ steht bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl-C₁-C₆-alkyl, Aryl oder Aryl-C₁-C₆-alkyl.
- R⁸ steht bevorzugt für C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Halogenalkyl.
- 10 R⁹ steht bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl-C₁-C₆-alkyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfache oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio substituiertes Aryl, Aryl-C₁-C₆-alkyl, 5- oder 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocycl oder Heterocycl-C₁-C₆-alkyl, welche jeweils 0 bis 4 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten.
- 15 R¹⁰ steht bevorzugt für Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, C₃-C₇-Cycloalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl-C₁-C₆-alkyl; oder für Aryl oder Aryl-C₁-C₆-alkyl, welche ihrerseits im Arylteil einfache oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C₁-C₆-Alkyl substituiert sein können.
- 20 R¹¹ steht bevorzugt für Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl.
- 25 R¹² und R¹³ stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Alkoxy.
- 30 R¹⁴ steht bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Halogenalkyl.

- R¹⁵ steht bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, Cyano oder Di(C₁-C₆-alkyl)amino.
- R¹⁶ steht bevorzugt für Wasserstoff; für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, C₂-C₆-Alkenyloxycarbonyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyloxy, C₂-C₆-Alkenylcarbonyloxy, Oxy(C₁-C₆-alkylen)oxy, Oxetanyl, Dioxanyl, Oxazolidinyl, Dioxolanyl, Aryloxy, Halogenaryloxy, -CONR⁴R⁵, -NR⁴R⁵, -ONR⁴R⁵, -C(R¹⁴)=N-OR¹⁴ substituiertes C₁-C₁₆-Alkyl, C₂-C₁₀-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyloxy substituiertes Aryl, Aryl-C₁-C₆-alkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl-C₁-C₆-alkyl, 4- bis 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C₁-C₆-alkyl, welche jeweils 0 bis 4 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten; oder für -NR⁴R⁵ oder für einen der Reste Q.
- R¹⁶ steht außerdem bevorzugt für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden substituiertes Aryl, Aryl-C₁-C₆-alkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl-C₁-C₆-alkyl, 4- bis 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C₁-C₆-alkyl, welche jeweils 0 bis 4 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten, wobei die Substituenten zusätzlich zu den oben genannten aus Hydroxy und Nitro ausgewählt werden können.
- R¹⁷ steht bevorzugt für Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl...

- 5 R¹⁸ steht bevorzugt für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, Oxy(C₁-C₆-alkylen)oxy substituiertes C₃-C₇-Cycloalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl-C₁-C₆-alkyl, Aryl, Aryl-C₁-C₆-alkyl, Heteroaryl oder Heteroaryl-C₁-C₆-alkyl welche jeweils 0 bis 4 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten; oder für -S(O)_pR³, -OR¹⁴ oder -NR⁴R⁵.
- 10 R¹⁸ steht außerdem bevorzugt für jeweils einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, C₂-C₆-Alkenyloxycarbonyl substituiertes C₁-C₆-Alkyl oder C₂-C₆-Alkenyl.
- 15 R¹⁸ steht außerdem bevorzugt für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden substituiertes C₃-C₇-Cycloalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl-C₁-C₆-alkyl, Aryl, Aryl-C₁-C₆-alkyl, Heteroaryl oder Heteroaryl-C₁-C₆-alkyl welche jeweils 0 bis 4 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten, wobei die Substituenten zusätzlich zu den oben genannten aus Nitro und C₁-C₆-Alkoxycarbonyl ausgewählt werden können.
- 20 R¹⁷ und R¹⁸ stehen außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, bevorzugt für einen 5- oder 6-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus, der 1 oder 2 weitere Heteroatome enthalten kann, welche 0 bis 2 Stickstoffatome, 0 oder 1 Sauerstoffatom und/oder 0 oder 1 Schwefelatom sein können, und der gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch C₁-C₆-Alkyl substituiert sein kann.
- 25 Q steht bevorzugt für eine der folgenden Gruppierungen



5

wobei die Reste R¹¹ die gleiche oder verschiedene Bedeutungen haben können, wenn sie mehrfach in derselben heterocyclischen Gruppierung vorkommen.

10

m steht bevorzugt für 0, 1, 2 oder 3, wobei die Wiederholungseinheit -(CHR¹⁴)- innerhalb der Seitenkette einer heterocyclischen Gruppierung die gleiche oder verschiedene Bedeutungen haben kann, wenn m für 2 oder 3 steht.

15

G steht bevorzugt für Sauerstoff oder Schwefel.

R¹⁹ und R²⁰ stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl oder gemeinsam für C₂-C₄-Alkylen.

5 R²¹ steht bevorzugt für Wasserstoff, für gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch C₁-C₆-Alkylcarbonyloxy oder C₁-C₆-Alkoxy substituiertes C₁-C₆-Alkyl; oder für gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₁-C₁₀-Alkoxycarbonyl, C₃-C₅-Alkylen substituiertes Aryl.

10 R²² steht bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl.

15 R²³ steht bevorzugt für Wasserstoff, Amino, C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl.

20 R¹ und R² stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₂-C₄-Alkenyl, C₂-C₄-Alkinyl, -S(O)_pR³, -NR⁴R⁵, -COR⁶, -CO₂R⁷, -CSR⁶, -CONR⁴R⁵, -NHCO₂R⁸, C₃-C₆-Cycloalkyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen substituiertes Aryl, Aryl-C₁-C₄-alkyl, 5- oder 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes, Heterocyclyl, welches 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthält.

R¹ und R² stehen außerdem gemeinsam besonders bevorzugt für C₃-C₅-Alkylen oder C₃-C₄-Alkenylen, wobei die Kohlenstoffkette durch 1 oder 2 Heteroatome, welche 0 bis 2 Stickstoffatome und/oder 0 oder 1 Sauerstoffatom sein können, unterbrochen sein kann und der dadurch gebildete Ring wiederum gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom oder C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann.

X steht besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Nitro, Cyano, Hydroxy, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₂-C₄-Alkenyl, C₂-C₄-Alkinyl, -S(O)_pR³, -NR⁴R⁵, -COR⁶, -CO₂R⁷, -CSR⁶, -CONR⁴R⁵, -NHCO₂R⁸, C₃-C₆-Cycloalkyl, Aryl, Aryl-C₁-C₄-alkyl, 5- oder 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes, Heterocyclyl, welches 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthält;

oder wenn n für 2 steht, stehen zwei benachbarte Reste X außerdem gemeinsam besonders bevorzugt für C₃-C₄-Alkylen oder C₃-C₄-Alkenylen, wobei die Kohlenstoffkette durch 1 oder 2 Heteroatome, welche 0 bis 2 Stickstoffatome und/oder 0 oder 1 Sauerstoffatom sein können, unterbrochen sein kann.

n steht besonders bevorzugt für 0, 1 oder 2, wobei X für gleiche oder verschiedene Reste steht, wenn n für 2 steht.

Y steht besonders bevorzugt für eine direkte Bindung, Sauerstoff, -S(O)_p- oder -NR⁹-.

p steht besonders bevorzugt für 0, 1 oder 2.

- 31 -

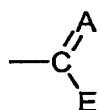
Z steht besonders bevorzugt für $-(CH_2)_r-$, $-(CH_2)_t-(CHR^{10})-(CH_2)_w-$,
 $-(CH_2)_r-C(O)-(CH_2)_t-$, $-(CH_2)_r-O-(CH_2)_t-$, $-(CH_2)_r-S(O)_p-(CH_2)_t-$,
 $-(CH_2)_r-N(R^{11})-(CH_2)_t-$ oder $-(CH_2)_t-C(R^{12})=C(R^{13})-(CH_2)_w-$.

5 r steht besonders bevorzugt für 1, 2, 3 oder 4.

t und w stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für 0, 1, 2, 3 oder 4.

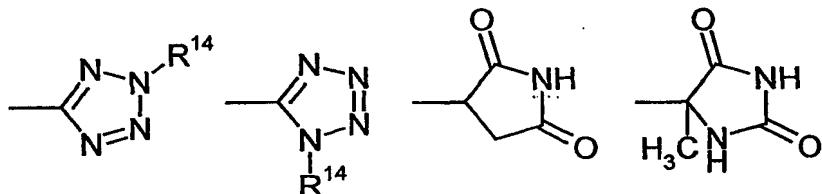
R steht besonders bevorzugt für die Gruppierung

10



oder für ein Carbonsäurebioisoster (Säuremimic), insbesondere aus der Gruppe

15



A steht besonders bevorzugt für Sauerstoff oder Schwefel.

20 E steht besonders bevorzugt für $-OR^{16}$, $-SR^{16}$, $-O^-M$, $-S^-M$ oder $-NR^{17}R^{18}$.

M steht besonders bevorzugt für gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch C₁-C₄-Alkyl, Phenyl, Benzyl oder Phenylethyl substituiertes Ammonium oder für ein Natriumkation (Na⁺) oder ein Kaliumkation (K⁺).

25

- M steht außerdem besonders bevorzugt für ein Magnesiumkation (Mg^{2+}) oder ein Calciumkation (Ca^{2+}), wobei jeweils zwei Moleküle einer Verbindung ein Salz mit einem solchen Ion bilden.
- 5 R³ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen substituiertes Aryl, Aryl-C₁-C₄-alkyl, 5- oder 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C₁-C₄-alkyl, welches 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten.
- 10 R⁴ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkylcarbonyl:
- 15 R⁵ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Amino, Formyl, C₁-C₄-Alkyl, C₂-C₄-Alkenyl, C₂-C₄-Alkinyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylcarbonyl, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl, Oxamoyl.
- 20 25 R⁴ und R⁵ stehen außerdem gemeinsam besonders bevorzugt für C₁-C₄-Alkyliden; oder für gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen substituiertes Benzyliden.
- 30 R⁴ und R⁵ stehen außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, besonders bevorzugt für einen 5- oder 6-gliedrigen, gesättigten oder un-

gesättigten Heterocyclus, der gegebenenfalls ein weiteres Stickstoff-, Sauerstoff- oder Schwefelatom enthalten kann und der gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann.

- 5 R⁶ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen oder Aryl-C₁-C₄-alkyl.
- 10 R⁷ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, Aryl oder Aryl-C₁-C₄-alkyl.
- 15 R⁸ steht besonders bevorzugt für C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen.
- 20 R⁹ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen substituiertes Aryl, Aryl-C₁-C₄-alkyl, 5- oder 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocycl oder Heterocycl-C₁-C₄-alkyl, welche 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten.
- 25 R¹⁰ steht besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkylcarbonyl, C₁-C₄-Alkoxy carbonyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl; oder für Aryl oder Aryl-C₁-C₄-alkyl, welche ihrerseits im Aryl teil einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom oder C₁-C₄-Alkyl substituiert sein können.

R¹¹ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl.

R¹² und R¹³ stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Wasserstoff, Hydroxy, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy.

5

R¹⁴ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen.

10

R¹⁵ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, Cyano oder Di(C₁-C₄-alkyl)amino.

15

R¹⁶ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff; für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl, C₂-C₄-Alkenyloxycarbonyl, C₁-C₄-Alkylcarbonyloxy, C₂-C₄-Alkenylcarbonyloxy, Oxy(C₁-C₄-alkylen)oxy, Oxetanyl, Dioxanyl, Oxazolidinyl, Dioxolanyl, Aryloxy, Halogenaryloxy, -CONR⁴R⁵, -NR⁴R⁵, -ONR⁴R⁵, -C(R¹⁴)=N-OR¹⁴ substituiertes C₁-C₆-Alkyl, Decyl, Dodecyl, Tetradecyl, Hexadecyl, C₂-C₆-Alkenyl, Decenyl, C₂-C₄-Alkinyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl, C₁-C₄-Alkylcarbonyloxy substituiertes Aryl, Aryl-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, 4- bis 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes, Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C₁-C₄-alkyl, welche jeweils 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten; oder für einen der Reste Q.

- 5 R¹⁶ steht außerdem besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls bis zur maximal möglichen Zahl, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor und/oder Brom substituiertes C₁-C₆-Alkyl, Decyl, Dodecyl, Tetradecyl, Hexadecyl, C₂-C₆-Alkenyl, Decenyl, C₂-C₄-Alkinyl.

10 R¹⁶ steht außerdem besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden substituiertes Aryl, Aryl-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, 4- bis 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes, Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C₁-C₄-alkyl, welche jeweils 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten, wobei die Substituenten zusätzlich zu den oben genannten aus Hydroxy und Nitro ausgewählt werden können.

15 R¹⁷ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl.

20 R¹⁸ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, C₁-C₄-Alkyl, C₂-C₄-Alkenyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Hydroxy, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, Oxy(C₁-C₄-alkylen)oxy substituiertes C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, Aryl, Aryl-C₁-C₄-alkyl, Heteroaryl oder Heteroaryl-C₁-C₄-alkyl, welche jeweils 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten; oder für -S(O)_pR³, -OR¹⁴ oder -NR⁴R⁵.

25 R¹⁸ steht außerdem besonders bevorzugt für jeweils einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor-

Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkoxy carbonyl, C₂-C₄-Alkenyloxy carbonyl substituiertes C₁-C₄-Alkyl oder C₂-C₄-Alkenyl; oder für jeweils gegebenenfalls bis zur maximal möglichen Zahl, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor und/oder Brom substituiertes C₁-C₄-Alkyl oder C₂-C₄-Alkenyl.

5

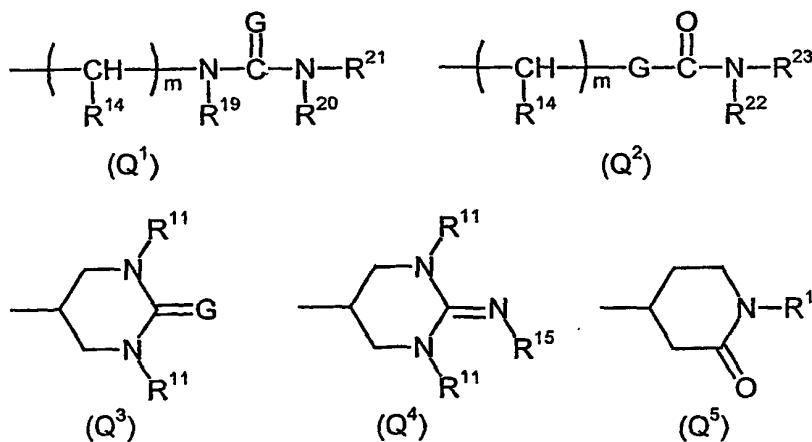
R¹⁸ steht außerdem besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden substituiertes C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, Aryl, Aryl-C₁-C₄-alkyl, Heteroaryl oder Heteroaryl-C₁-C₄-alkyl, welche jeweils 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten, wobei die Substituenten zusätzlich zu den oben genannten aus Nitro und C₁-C₆-Alkoxy carbonyl ausgewählt werden können.

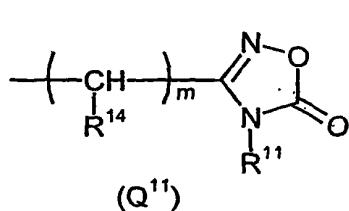
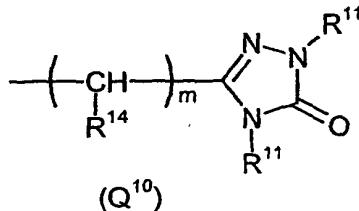
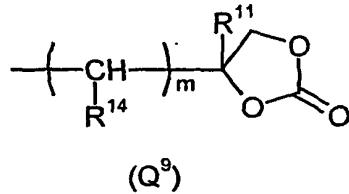
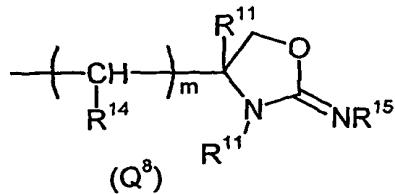
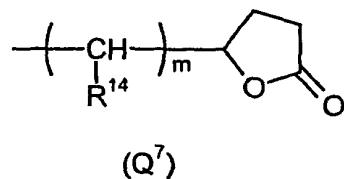
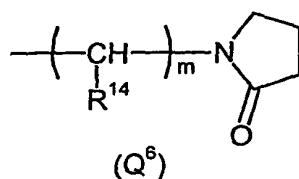
10

R¹⁷ und R¹⁸ stehen außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, besonders bevorzugt für einen 5- oder 6-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus, der 1 oder 2 weitere Heteroatome enthalten kann, welche 0 bis 2 Stickstoffatome, 0 oder 1 Sauerstoffatom und/oder 0 oder 1 Schwefelatom sein können, und der gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann.

15

Q steht besonders bevorzugt für eine der folgenden Gruppierungen





5 wobei die Reste R¹¹ die gleiche oder verschiedene Bedeutungen haben können, wenn sie mehrfach in derselben heterocyclischen Gruppierung vorkommen.

10 m steht besonders bevorzugt für 0, 1, 2 oder 3, wobei die Wiederholungseinheit -(CHR¹⁴)- innerhalb der Seitenkette einer heterocyclischen Gruppierung die gleiche oder verschiedene Bedeutungen haben kann, wenn m für 2 oder 3 steht.

G steht besonders bevorzugt für Sauerstoff oder Schwefel.

15 R¹⁹ und R²⁰ stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder gemeinsam für C₂-C₃-Alkylen.

20 R²¹ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, für gegebenenfalls einfach bis zweifach, gleich oder verschieden durch C₁-C₄-Alkylcarbonyloxy oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes C₁-C₄-Alkyl; oder für gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen,

C₁-C₄-Alkylcarbonyl, C₁-C₈-Alkoxycarbonyl, C₃-C₅-Alkylen substituiertes Aryl.

5 R²² steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl.

R²³ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Amino, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl.

10 R¹ und R² stehen unabhängig voneinander ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Nitro, Cyano, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, -CF₃, -CCl₃, -CHF₂, -CClF₂, -CHCl₂, -CF₂CHFCI, -CF₂CH₂F, -CF₂CCl₃, -CH₂CF₃, -CF₂CHFCF₃, -CH₂CF₂H, -CH₂CF₂CF₃, -CF₂CF₂H, -CF₂CHFCF₃, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, i-Propoxy, n-Butoxy, Trifluormethoxy, Trichlormethoxy, -OCH₂CF₃, -SCF₃, -SCHF₂, -SO₂Me, -SO₂CHF₂, -SO₂CF₃, -SOCHF₂, -SOCF₃, -COMe, -CO₂Me, -CO₂Et, Amino, Cyclopentyl, Cyclohexyl; jeweils gegebenenfalls durch Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl, Trifluormethoxy substituiertes Phenyl, Benzyl, Pyridinyl, Furyl, Furfuryl.

15

20

R¹ und R² stehen außerdem gemeinsam ganz besonders bevorzugt für Propylen, Butylen, Propenylen oder Butadienylen, -(CH₂)₂-O-CH₂-, -(CH₂)₂-NH-CH₂-, -CH=CH-N=CH-, -CH=CCl-CH=CH-.

25 X steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Nitro, Cyano, Hydroxy, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, -CF₃, -CCl₃, -CHF₂, -CClF₂, -CHCl₂, -CF₂CHFCI, -CF₂CH₂F, -CF₂CCl₃, -CH₂CF₃, -CF₂CHFCF₃, -CH₂CF₂H, -CH₂CF₂CF₃, -CF₂CF₂H, -CF₂CHFCF₃, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, i-Propoxy, n-Butoxy, Trifluormethoxy, Trichlormethoxy, -OCH₂CF₃, -SCF₃, -SCHF₂, -SO₂Me, -SO₂CHF₂, -SO₂CF₃, -SOCHF₂, -SOCF₃, -COMe, -CO₂Me, -CO₂Et, Amino, -CH=CH₂, -C≡CH, Amino,

30

5 -NHMe, -NMe₂, -CHO, -COMe, -CO₂Me, -CO₂Et, -NHCOMe, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Phenyl, Benzyl, Furyl, Thienyl, Pyrrolyl, Oxazolyl, Isoxazyl, Imidazyl, Pyrazyl, Thiazolyl, Pyridyl, Pyrimidinyl, Pyridazyl, Triazinyl, Triazyl; oder wenn n für 2 steht, stehen zwei benachbarte Reste X außerdem gemeinsam ganz besonders bevorzugt für Propylen, Butylen, Propenylen oder Butadienylen, -(CH₂)₂-O-CH₂-, -(CH₂)₂-NH-CH₂-, -CH=CH-N=CH-.

10 X steht außerdem ganz besonders bevorzugt für Methylthio, Ethylthio, n-Propylthio, i-Propylthio.

15 n steht ganz besonders bevorzugt für 0, 1 oder 2, wobei X für gleiche oder verschiedene Reste steht, wenn n für 2 steht.

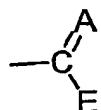
20 Y steht ganz besonders bevorzugt für eine direkte Bindung, Sauerstoff, -S(O)_p- oder -NR⁹-.

25 p steht ganz besonders bevorzugt für 0, 1 oder 2.

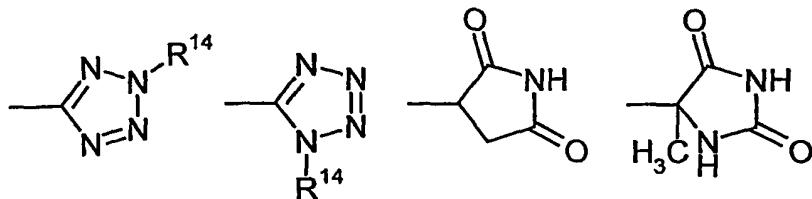
30 Z steht ganz besonders bevorzugt für -CH₂-, -(CH₂)₂-, -(CH₂)₃-, -(CH₂)₄-, -(CHR¹⁰)-, -CH₂-C(O)-CH₂-, -CH₂-NH-, -CH=CH-, -CH₂-CH=CH-, -CH=C(OH)-, -CH=C(OMe)-, -CH₂-C(OMe)=CH-.

Z steht außerdem ganz besonders bevorzugt für -CH₂-C(OEt)=CH-.

25 R steht ganz besonders bevorzugt für die Gruppierung



oder für ein Carbonsäurebioisoster (Säuremimic), insbesondere aus der Gruppe



- A steht ganz besonders bevorzugt für Sauerstoff oder Schwefel.
- 5 E steht ganz besonders bevorzugt für -OR¹⁶, -SR¹⁶, -O-M oder -NR¹⁷R¹⁸.
- M steht ganz besonders bevorzugt für Tetrabutylammonium, Trimethylbenzylammonium oder für ein Natriumkation (Na⁺) oder ein Kaliumkation (K⁺).
- 10 M steht außerdem ganz besonders bevorzugt für ein Magnesiumkation (Mg²⁺) oder ein Calciumkation (Ca²⁺), wobei jeweils zwei Moleküle einer Verbindung ein Salz mit einem solchen Ion bilden.
- 15 R⁴ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, -COMe.
- 20 R⁵ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Amino, Formyl, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, Vinyl, Propargyl, Methoxy, Methoxymethyl, -COMe, -COEt, t-Butoxycarbonyl, Oxamoyl.
- R⁴ und R⁵ stehen außerdem gemeinsam ganz besonders bevorzugt für Ethylen, i-Propyliden, s-Butyliden, Nitrobenzyliden.
- 25 R⁴ und R⁵ stehen außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, ganz besonders bevorzugt für einen 5- oder 6-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus aus der Reihe Morphin, Piperidin, Thiomorpholin, Pyrrolidin, Tetrahydropyridin, der gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl substituiert sein kann.

- 18 R⁸ steht ganz besonders bevorzugt für Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, -CF₃, -CCl₃, -CHF₂, -CClF₂, -CHCl₂, -CF₂CHFCl, -CF₂CH₂F, -CF₂CCl₃, -CH₂CF₃, -CF₂CHFCF₃, -CH₂CF₂H, -CH₂CF₂CF₃, -CF₂CF₂H oder für -CF₂CHFCF₃.
- 5 R⁹ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, -CH₂CF₃, -CH₂CF₂H, -CH₂CF₂CF₃, Cyclopropyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl.
- 10 R¹⁰ steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, -COMe, -COEt, -CO₂Me, -CO₂Et, Cyclohexyl; Phenyl oder Benzyl, welche ihrerseits im Arylteil einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom oder Methyl substituiert sein können.
- 15 R¹¹ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl.
- 20 R¹⁴ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl oder t-Butyl.
- R¹⁵ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl oder Cyano.
- 25 R¹⁶ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff; für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, Methoxy, Ethoxy, i-Propoxy, Trifluormethoxy, -OCH₂CF₃, Trichlormethoxy, Difluormethoxy, Methylthio, Tri-fluormethylthio, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, i-Propoxycarbonyl, t-Butoxycarbonyl, Methylcarbonyloxy, Vinylcarbonyloxy, -O-(CH₂)₂-O-, Oxetanyl, Dioxanyl, Oxazolidinyl, Dioxolanyl, Phenoxy, Fluorphenoxy, -CONR⁴R⁵, -NR⁴R⁵, -ONR⁴R⁵, -CH=N-OCH₃ substituiertes Methyl, Ethyl,
- 30

n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, n-Pentyl, Isopentyl,
Siamyl, Hexyl, n-Decyl, n-Dodecyl, n-Tetradecyl, n-Hexadecyl, Vinyl, Allyl,
Butenyl, 2-Isopentenyl, Hexenyl, n-Decenyl, Ethinyl, Propinyl, Butinyl; oder
für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch
5 Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl,
i-Butyl, t-Butyl, -CF₃, -CCl₃, -CHF₂, -CClF₂, -CHCl₂, -CF₂CHFCl,
-CF₂CH₂F, -CF₂CCl₃, -CH₂CF₃, -CF₂CHFCF₃, -CH₂CF₂H, -CH₂CF₂CF₃,
-CF₂CF₂H, -CF₂CHFCF₃, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, n-Butoxy, Trifluor-
methoxy, Trichlormethoxy, Methylthio, Trifluormethylthio, -CO₂Me,
10 -CO₂Et, Methylcarbonyloxy, Ethylcarbonyloxy substituiertes Phenyl, Benzyl,
Phenylethyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopropyl-
methyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl, Cyclohexylmethyl, Cyclo-
propylethyl, Cyclobutylethyl, Cyclopentylethyl, Cyclohexylethyl, Oxetanyl,
15 Oxazolanyl, Dioxanyl, Dioxolanyl, Furyl, Thienyl, Pyrrolyl, Oxazolyl, Isoxa-
zyl, Imidazolyl, Pyrazyl, Thiazolyl, Pyridinyl, Pyrimidinyl, Pyridazyl,
Triazinyl, Triazolyl, Tetrahydropyranyl, Thietanyl, Thietandioxid, Oxetanyl-
methyl, Oxazolanylmethyl, Dioxanylmethyl, Dioxolanylmethyl, Furylmethyl,
Thienylmethyl, Pyrrolylmethyl, Oxazolylmethyl, Isoxazylmethyl, Imidazo-
lylmethyl, Pyrazylmethyl, Thiazolylmethyl, Pyridinylmethyl, Pyrimidinyl-
20 methyl, Pyridazylmethyl, Triazinylmethyl, Triazolylmethyl, Tetrahydro-
pyranylmethyl, Thietanylmethyl, Thietandioxidmethyl, Oxetanylethyl, Oxazo-
lanylethyl, Dioxanylethyl, Dioxolanylethyl, Furylethyl, Thienylethyl,
Pyrrolylethyl, Oxazolylethyl, Isoxazylethyl, Imidazolylethyl, Pyrazylethyl,
Thiazolylethyl, Pyridinylethyl, Pyrimidinylethyl, Pyridazylethyl, Triazinyl-
ethyl, Triazolylethyl, Tetrahydropyranylethyl, Thietanylethyl, Thietandioxid-
ethyl; oder für einen der Reste Q.

R¹⁶ steht außerdem ganz besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls bis zur
maximal möglichen Zahl, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor
und/oder Brom substituiertes Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl,
30 s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, n-Pentyl, Isopentyl, Siamyl, Hexyl, n-Decyl,

n-Dodecyl, n-Tetradecyl, n-Hexadecyl, Vinyl, Allyl, Butenyl, 2-Isopentenyl, Hexenyl, n-Decenyl, Ethinyl, Propinyl, Butinyl.

- R¹⁶ steht außerdem ganz besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden substituiertes Phenyl, Benzyl, Phenylethyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl, Cyclohexylmethyl, Cyclopropylethyl, Cyclobutylethyl, Cyclopentylethyl, Cyclohexylethyl, Oxetanyl, Oxazolanyl, Dioxanyl, Dioxolanyl, Furyl, Thienyl, Pyrrolyl, Oxazolyl, Isoxazyl, Imidazolyl, Pyrazyl, Thiazolyl, Pyridinyl, Pyrimidinyl, Pyridazyl, Triazinyl, Triazolyl, Tetrahydropyranyl, Thietanyl, Thietandioxid, Oxetanylmethyl, Oxazolanylmethyl, Dioxanylmethyl, Dioxolanylmethyl, Furylmethyl, Thienylmethyl, Pyrrolylmethyl, Oxazolylmethyl, Isoxazylmethyl, Imidazolylmethyl, Pyrazylmethyl, Thiazolylmethyl, Pyridinylmethyl, Pyrimidinylmethyl, Pyridazylmethyl, Triazinylmethyl, Triazolylmethyl, Tetrahydropyranylmethyl, Thietanylmethyl, Thietandioxidmethyl, Oxetanylethyl, Oxazolylethyl, Dioxanylethyl, Dioxolanylethyl, Furylethyl, Thienylethyl, Pyrrolylethyl, Oxazolylethyl, Isoxazolylethyl, Imidazolylethyl, Pyrazylethyl, Thiazolylethyl, Pyridinylethyl, Pyrimidinylethyl, Pyridazylethyl, Triazinyl-ethyl, Triazolylethyl, Tetrahydropyranylethyl, Thietanylethyl, Thietandioxid-ethyl, wobei die Substituenten zusätzlich zu den oben genannten aus Hydroxy und Nitro ausgewählt werden können.
- R¹⁷ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl oder Ethyl.
- R¹⁸ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, Vinyl, Allyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Hydroxy, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethoxy, Methylthio, Trifluormethylthio, -O-CH₂-O- substituiertes Cyclopropyl, Cyclopropylmethyl, Cyclohexyl, Phenyl, Benzyl, Phenylethyl, Pyri-

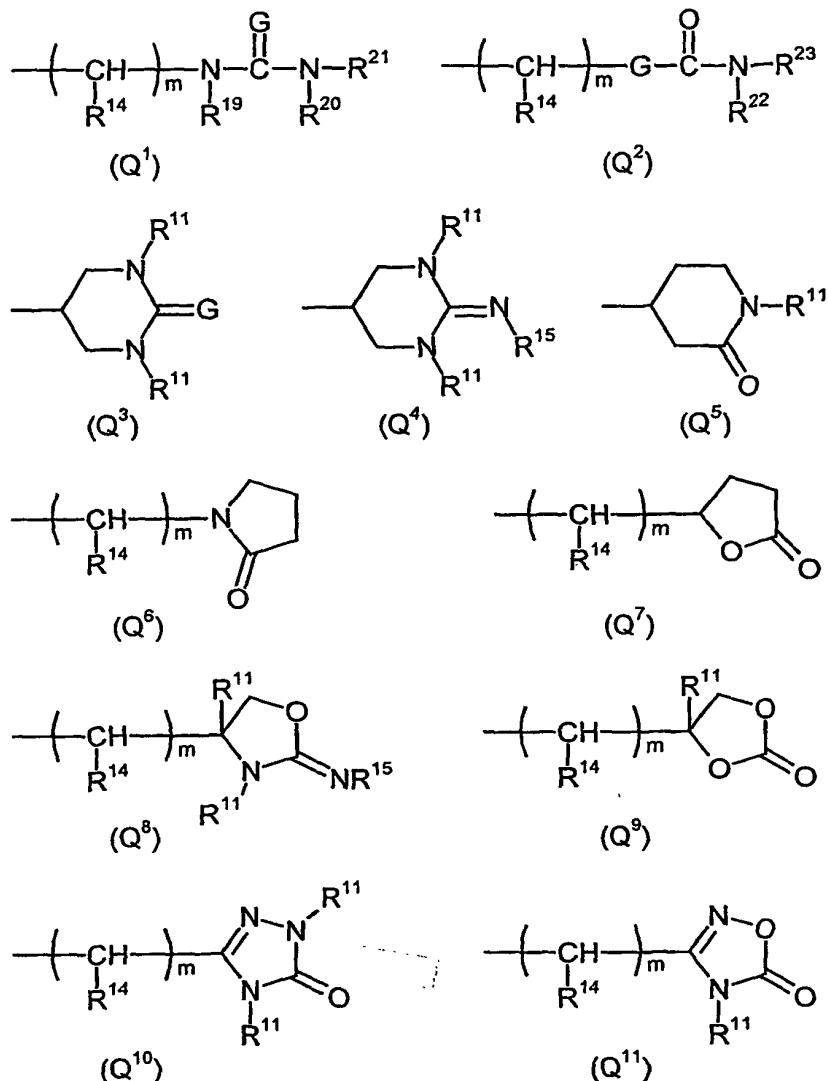
dinyl, Pyridinylmethyl, Pyridinylethyl, Furyl, Furfuryl; oder für $\text{-SO}_2\text{Me}$, $\text{-SO}_2\text{Et}$ oder $\text{-NR}^4\text{R}^5$.

5 R¹⁸ steht außerdem ganz besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, Methoxy, Ethoxy, i-Propoxy, Trifluormethoxy, $\text{-OCH}_2\text{CF}_3$, Trichlormethoxy, Difluormethoxy, Methylthio, Trifluormethylthio, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, i-Propoxycarbonyl, t-Butoxycarbonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, Vinyl, Allyl; oder für jeweils gegebenenfalls bis zur maximal möglichen Zahl, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor und/oder Brom substituiertes Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, Vinyl, Allyl.

10 R¹⁸ steht außerdem ganz besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden substituiertes Cyclopropyl, Cyclopropylmethyl, Cyclohexyl, Phenyl, Benzyl, Phenylethyl, Pyridinyl, Pyridinylmethyl, Pyridinylethyl, Furyl, Furfuryl, wobei die Substituenten zusätzlich zu den oben genannten aus Nitro, Methoxycarbonyl und Ethoxycarbonyl ausgewählt werden können.

15 R¹⁷ und R¹⁸ stehen außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, ganz besonders bevorzugt für einen 5- oder 6-gliedrigen gesättigten Heterocyclus aus der Reihe Piperazin, Morpholin, Piperidin, Pyrrolidin, welcher gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Methyl, Ethyl, n-Propyl oder i-Propyl substituiert sein kann.

20 Q steht ganz besonders bevorzugt für eine der folgenden Gruppierungen



5

wobei die Reste R¹¹ die gleiche oder verschiedene Bedeutungen haben können, wenn sie mehrfach in derselben heterocyclischen Gruppierung vorkommen.

10

m steht ganz besonders bevorzugt für 0, 1, 2 oder 3, wobei die Wiederholungseinheit -(CHR¹⁴)- innerhalb der Seitenkette einer heterocyclischen Gruppierung die gleiche oder verschiedene Bedeutungen haben kann, wenn m für 2 oder 3 steht.

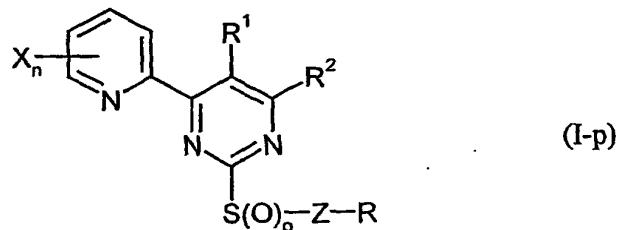
15

G steht ganz besonders bevorzugt für Sauerstoff oder Schwefel.

R¹⁹ und R²⁰ stehen unabhängig voneinander ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, oder gemeinsam für -(CH₂)₂- oder -(CH₂)₃-.

- 5 R²¹ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls einfach durch t-Butylcarbonyloxy oder Methoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach oder zweifach, gleich oder verschieden durch Chlor, Cyano, Methyl, Ethyl, t-Butyl, Trifluormethyl, s-Butyloxycarbonyl, t-Butyloxycarbonyl, n-Octyloxycarbonyl, -(CH₂)₄- substituiertes Phenyl.
- 10 R²² steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl oder Methoxymethyl.
- 15 R²³ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Amino, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl oder Methoxymethyl.

Insbesondere ganz besonders bevorzugt sind Pyridylpyrimidine der Formel (I-p)

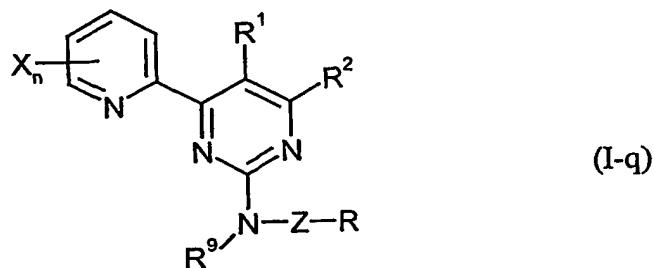


20

in welcher

R¹, R², X, n, p, Z und R die oben angegebenen Bedeutungen haben.

25 Insbesondere ganz besonders bevorzugt sind Pyridylpyrimidine der Formel (I-q)

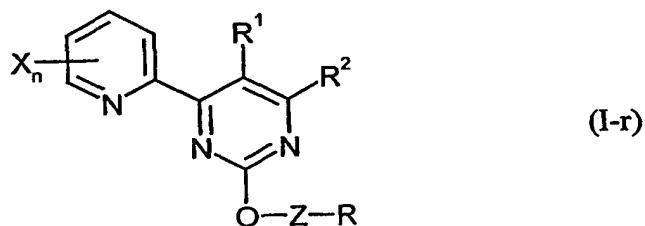


in welcher

R^1, R^2, X, n, Z, R und R^9 die oben angegebenen Bedeutungen haben.

5

Insbesondere ganz besonders bevorzugt sind Pyridylpyrimidine der Formel (I-r)

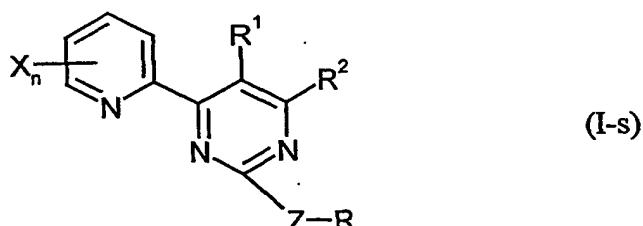


in welcher

10

R^1, R^2, X, n, Z und R die oben angegebenen Bedeutungen haben.

Insbesondere ganz besonders bevorzugt sind Pyridylpyrimidine der Formel (I-s)

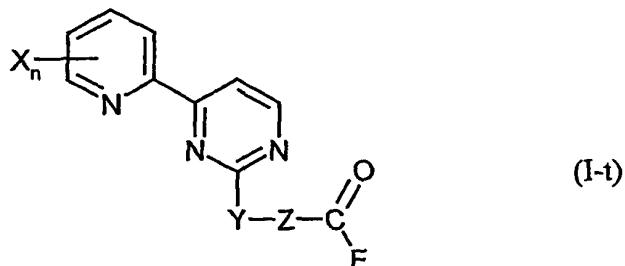


15

in welcher

R^1, R^2, X, n, Z und R die oben angegebenen Bedeutungen haben.

Insbesondere ganz besonders bevorzugt sind Pyridylpyrimidine der Formel (I-t)



in welcher

5

X für Methyl, Ethyl, Chlor, Brom, -CF₃, Methoxy oder Trifluormethoxy steht,

n für 0, 1 oder 2 steht, wobei X für gleiche oder verschiedene Reste steht, wenn
n für 2 steht,

10

Y für -S- oder -NR⁹- steht,

Z für -CH₂- oder -(CH₂)₂- steht,

15

E für Hydroxy, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, i-Propoxy, n-Butoxy, i-Butoxy,
s-Butoxy, t-Butoxy, -NH-SO₂Me oder -NH-SO₂Et steht,

R⁹ für Wasserstoff, Methyl oder Ethyl steht.

20

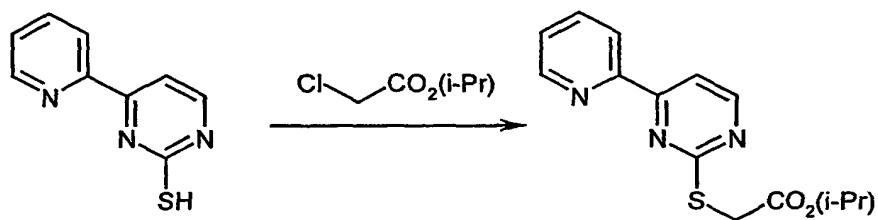
Gesättigte Kohlenwasserstoffreste wie Alkyl können, auch in Verbindung mit Heteroatomen, wie z.B. in Alkoxy, soweit möglich, jeweils geradkettig oder verzweigt sein.

25

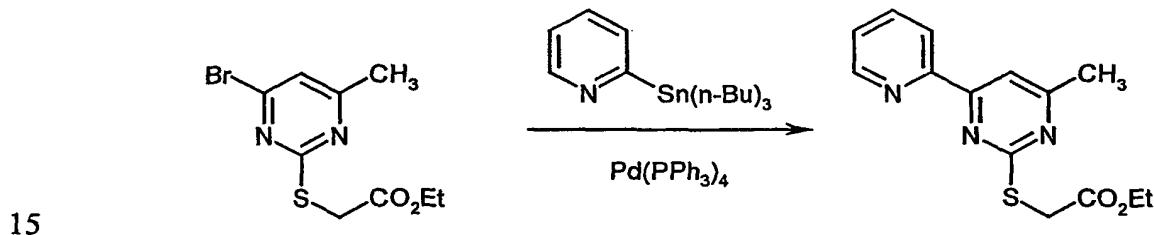
Die oben aufgeführten allgemeinen oder in Vorzugsbereichen aufgeführten Restedefinitionen bzw. Erläuterungen können jedoch auch untereinander, also zwischen den jeweiligen Bereichen und Vorzugsbereichen beliebig kombiniert

werden. Sie gelten für die Endprodukte sowie für die Vor- und Zwischenprodukte entsprechend.

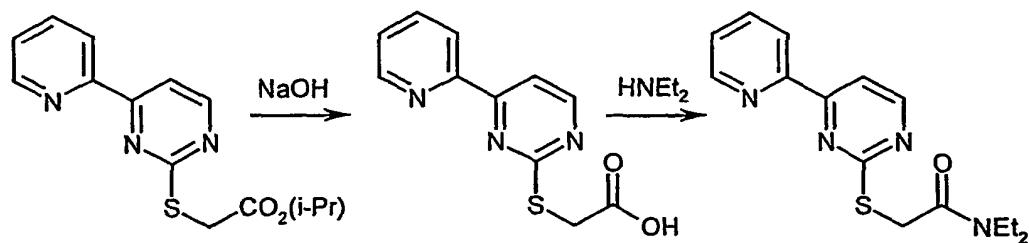
- 5 Verwendet man 4-(2-Pyridinyl)-2-pyrimidinylthiol und 2-Chloressigsäureisopropylester als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (A) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.



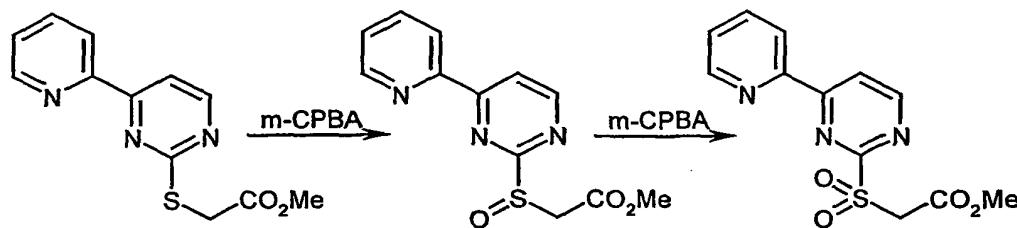
- 10 Verwendet man Ethyl-[(4-brom-6-methyl-2-pyrimidinyl)thio]acetat, 2-(Tributylstannylyl)pyridin und einen Palladium-Katalysator als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (B) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.



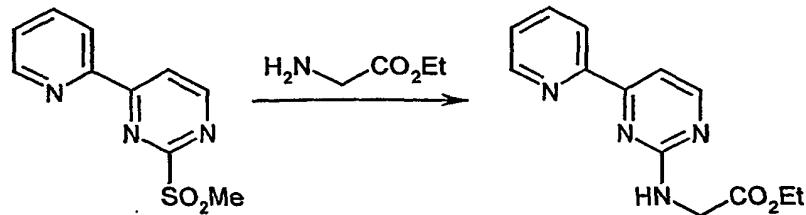
- 15 Verwendet man Isopropyl-{[4-(2-pyridinyl)-2-pyrimidinyl]thio}acetat als Ausgangsstoff und Natronlauge und Diethylamin als Reaktionshilfsmittel, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (C) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.



5 Verwendet man Methyl-{[4-(2-pyridinyl)-2-pyrimidinyl]thio}acetat als Ausgangsstoff und meta-Chlorperbenzoësäure (m-CPBA) als Oxidationsmittel, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (D) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.

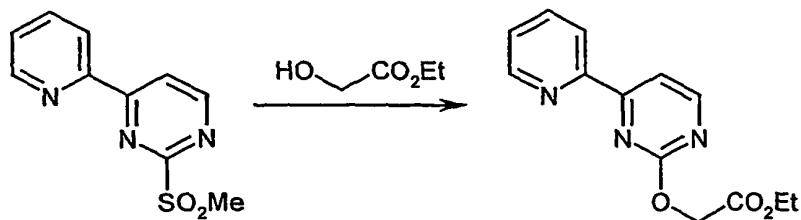


10 Verwendet man 2-(Methylsulfonyl)-4-(2-pyridinyl)pyrimidin und Glycinethylester als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (E) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.

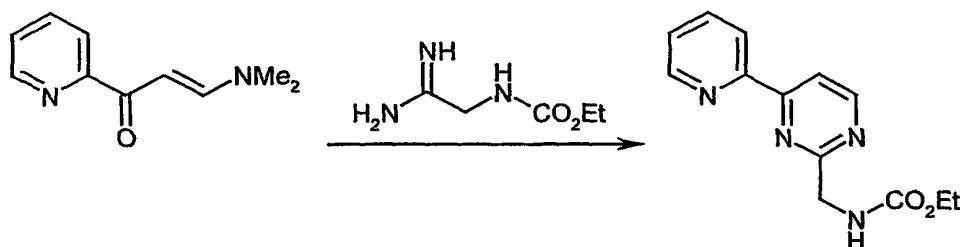


15

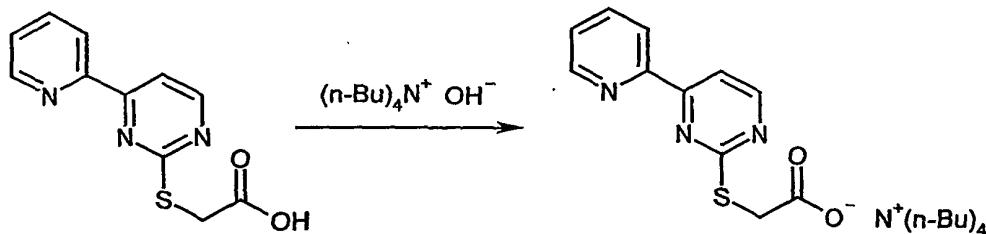
Verwendet man 2-(Methylsulfonyl)-4-(2-pyridinyl)pyrimidin und Glykolsäureethylester als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (F) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.



Verwendet man 3-(Dimethyl-amino)-1-(2-pyridinyl)-2-propen-1-on und Methyl-2-amino-2-iminoethylcarbamat als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (G) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.

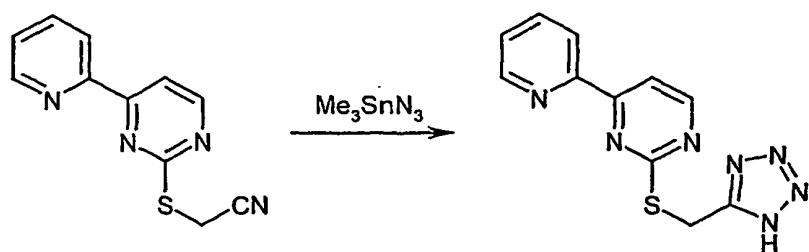


Verwendet man {[4-(2-Pyridinyl)-2-pyrimidinyl]thio}essigsäure und Tetrabutylammoniumhydroxid als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (H) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.

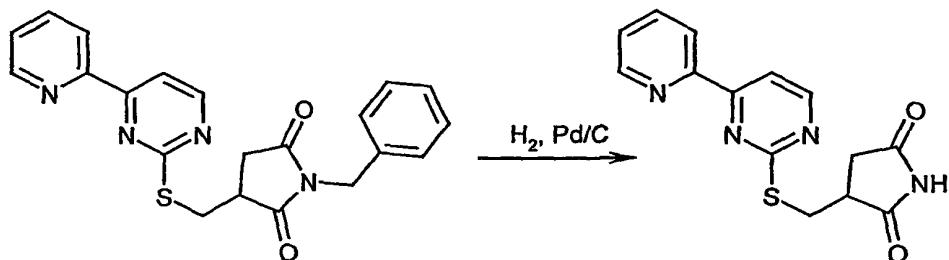


Verwendet man {[4-(2-Pyridinyl)-2-pyrimidinyl]thio}acetonitril und Trimethylzinnazid als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (J) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.

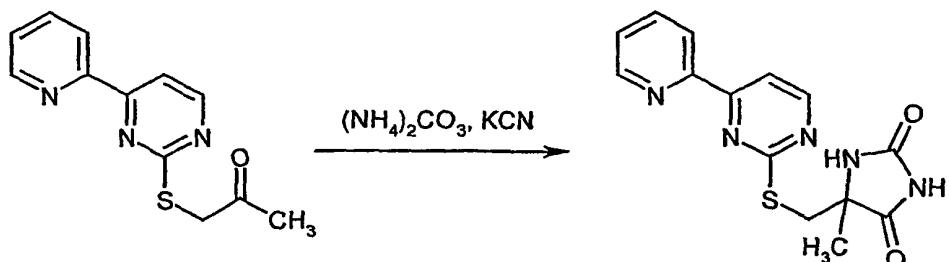
- 52 -



5 Verwendet man 1-Benzyl-3-({[4-(2-pyridinyl)-2-pyrimidinyl]thio}methyl)-2,5-pyrrolidindion und Wasserstoff als Ausgangsstoffe, sowie Palladium/Aktivkohle als Katalysator, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (K) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.



10 Verwendet man 1-{{[4-(2-Pyridinyl)-2-pyrimidinyl]thio}acetone, Kaliumcyanid und Ammoniumcarbonat als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (L) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.

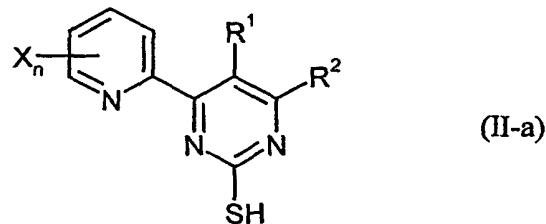


15

Erläuterung der Verfahren und ZwischenprodukteVerfahren (A)

- 5 Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (A) als Ausgangsstoffe benötigten Thiole sind durch die Formel (II) allgemein definiert. In dieser Formel stehen R¹, R², X und n bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.
- 10

Die Thiole der Formel (II-a)

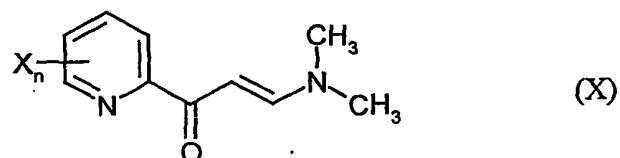


- 15 in welcher

R¹, R², X und n die oben angegebenen Bedeutungen haben mit der Maßgabe, dass wenigstens einer der Reste R¹, R² oder X nicht für Wasserstoff steht,

- 20 sind neu. Sie lassen sich herstellen, indem man

a) Pyridin-Derivate der Formel (X)



- 25 in welcher

X und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

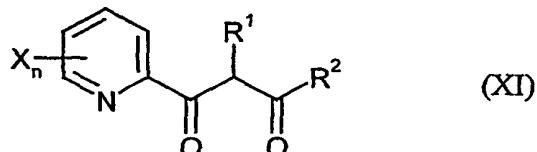
mit Thioharnstoff gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels (z.B. Methanol, Wasser) und gegebenenfalls in Gegenwart einer Base (z.B. Natriumhydroxid, Natriummethanolat) umsetzt,

5

oder

b) Pyridin-Derivate der Formel (XI)

10



in welcher

R¹, R², X und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

15

mit Thioharnstoff gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels (z.B. Methanol, Wasser) und gegebenenfalls in Gegenwart einer Base (z.B. Natriumhydroxid, Natriummethanolat) oder einer Säure (z.B. Salzsäure oder Trifluoressigsäure) umsetzt.

20

Die bei der Durchführung der Verfahren (a) und (b) als Ausgangsstoffe benötigten Pyridin-Derivate sind durch die Formeln (X) und (XI) allgemein definiert. In diesen Formeln stehen R¹, R², X und n bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

25

Pyridin-Derivate der Formeln (X) und (XI) sind bekannt und/oder lassen sich nach bekannten Verfahren herstellen (vgl. J. Chem. Soc., Dalton Trans. 1999, 3095, J. Amer. Chem. Soc. 1951, 73, 5614).

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (A) als Ausgangsstoffe benötigten Halogen-Verbindungen sind durch die Formel (III) allgemein definiert. In dieser Formel stehen Z und A bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden. E¹ steht bevorzugt für -OR¹⁶, -SR¹⁶ oder -NR¹⁷R¹⁸, besonders bevorzugt für -OR¹⁶ oder -SR¹⁶, wobei R¹⁶, R¹⁷ und R¹⁸ jeweils bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen stehen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden. Hal¹ steht bevorzugt für Chlor, Brom oder Iod, besonders bevorzugt für Chlor oder Brom.

Halogen-Verbindungen der Formel (III) sind bekannt und/oder lassen sich nach bekannten Verfahren herstellen.

Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (A) jeweils alle üblichen inerten, organischen Solventien in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind gegebenenfalls halogenierte aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid oder Sulfone, wie Sulfolan. Besonders bevorzugt verwendet man Acetonitril oder Dimethylformamid.

Als Säurebindemittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (A) jeweils alle für derartige Reaktionen üblichen anorganischen und organischen Basen in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind Erdalkali- oder Alkalimetallhydroxide, wie Natriumhydroxid, Calciumhydroxid, Kaliumhydroxid, oder auch Ammoniumhydroxid, Alkalimetallhydride, wie Natriumhydrid, Alkalimetallcarbonate, wie Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat, Natriumhydrogencarbonat, Alkali- oder Erdalkalimetallacetate wie Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU). Besonders bevorzugt verwendet man Alkalimetallcarbonate oder –hydride, ganz besonders bevorzugt Kaliumcarbonat.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (A) jeweils in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen –20°C und 200°C, vorzugsweise zwischen 0°C und 150°C, ganz besonders bevorzugt zwischen 20°C und 100°C.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (A) setzt man auf 1 Mol an Verbindung der Formel (II) im allgemeinen 1 Mol oder einen leichten Überschuss an Verbindung der Formel (III), sowie 1-10 Mol an Säurebindemittel ein. Es ist jedoch auch möglich, die Reaktionskomponenten in anderen Verhältnissen einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen verfährt man in der Weise, dass man das Reaktionsgemisch einengt, extrahiert, die organische Phase wäscht, trocknet, filtriert und eingeengt. Der Rückstand wird gegebenenfalls nach üblichen Methoden, wie Chromatographie oder Umkristallisation, von eventuell noch vorhandenen Verunreinigungen befreit.

Verfahren (B)

30

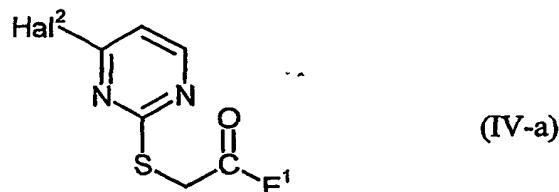
Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (B) als Ausgangsstoffe benötigten Halogenpyrimidine sind durch die Formel (IV) allgemein definiert. In

dieser Formel stehen R¹, R², Z und A bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden. E¹ steht bevorzugt für -OR¹⁶, 5 -SR¹⁶ oder -NR¹⁷R¹⁸, besonders bevorzugt für -OR¹⁶ oder -SR¹⁶, wobei R¹⁶, R¹⁷ und R¹⁸ jeweils bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen stehen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden. Hal² steht bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom oder Iod, 10 besonders bevorzugt für Chlor, Brom oder Iod, ganz besonders bevorzugt für Chlor oder Brom.

Die Halogenpyrimidine der Formel (IV) sind teilweise bekannt und/oder lassen sich nach bekannten Verfahren herstellen (vgl. US 3,910,910).

15

Halogenpyrimidine der Formel (IV-a)



in welcher

20

- a) E¹ für Methoxy oder Ethoxy steht und
Hal² für Brom steht,

oder

25

- b) E¹ für Methoxy steht und
Hal² für Chlor steht,

sind neu.

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (B) als Ausgangsstoffe benötigten Pyridin-Verbindungen sind durch die Formel (V) allgemein definiert. In dieser Formel stehen X und n bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden. L steht bevorzugt für Sn(n-Bu)₃, Sn(Me)₃, Sn(Phenyl)₃, ZnBr oder ZnCl, besonders bevorzugt für Sn(n-Bu)₃, Sn(Me)₃, Sn(Phenyl)₃ oder ZnBr, ganz besonders bevorzugt für Sn(n-Bu)₃, Sn(Me)₃ oder ZnBr.

10

Pyridin-Verbindungen der Formel (V) sind bekannt und/oder lassen sich nach bekannten Verfahren herstellen.

15

Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (B) jeweils alle üblichen inerten, organischen Solventien in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind gegebenenfalls halogenierte aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid. Besonders bevorzugt verwendet man aromatische Kohlenwasserstoffe, ganz besonders bevorzugt Benzol, Toluol oder Xylol.

25

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (B) setzt man im allgemeinen einen Palladium-Katalysator ein, der wiederum mit oder ohne Zusatz von weiteren Liganden verwendet werden kann. Vorzugsweise verwendet man als Katalysator PdCl₂(dppf) [dppf = 1,1'-Bis(diphenylphosphino)ferrocene], Pd(PPh₃)₄, PdCl₂(PPh₃)₂, PdCl₂(CH₃CN)₂, Pd₂(dba)₃ [dba = Dibenzylidenaceton] oder

Pd(OAc)₂, besonders bevorzugt PdCl₂(dppf), Pd(PPh₃)₄, PdCl₂(PPh₃)₂, oder Pd(OAc)₂, ganz besonders bevorzugt PdCl₂(dppf) oder Pd(PPh₃)₄.

Als Liganden kommen Triarylphosphine, Trialkylphosphine oder Arsine in Frage.
5 Vorzugsweise verwendet man dppf, PPh₃, P(t-Bu)₃, Pcy₃ oder AsPh₃, besonders bevorzugt dppf.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (B) jeweils in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen 10 arbeitet man bei Temperaturen zwischen -20°C und 200°C, vorzugsweise zwischen 0°C und 150°C.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (B) setzt man auf 1 Mol an Verbindung der Formel (IV) im allgemeinen 1 Mol oder einen leichten Überschuss 15 an Verbindung der Formel (V), sowie 1-5 Mol% an Katalysator ein. Es ist jedoch auch möglich, die Reaktionskomponenten in anderen Verhältnissen einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen verfährt man in der Weise, dass man das Reaktionsgemisch einengt und das Rohprodukt nach üblichen Methoden, wie Chromatographie oder Umkristallisation, von eventuell vorhandenen 20 Verunreinigungen befreit.

Verfahren (C)

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (C) als Ausgangsstoffe 25 benötigten Pyridylpyrimidine sind durch die Formel (I-c) allgemein definiert. In dieser Formel stehen R¹, R², X, n, Z und A bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste 30 als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden. E³ steht bevorzugt für -OR¹⁶, wobei R¹⁶ bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen stehen, die bereits in Zusammenhang mit der

Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

5 Die Pyridylpyrimidine der Formel (I-c) fallen unter die Definition der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) und werden nach einem der Verfahren (A) oder (B) hergestellt.

10 Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (C) als Zwischenprodukte entstehenden Pyridylpyrimidine sind durch die Formel (I-d) allgemein definiert. In dieser Formel stehen R¹, R², X, n, Z und A bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

15 15 Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (C) als Ausgangsstoffe benötigten Amine sind durch die Formel (VI) allgemein definiert. In dieser Formel stehen R¹⁷ und R¹⁸ bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

Amine der Formel (VI) sind bekannt und/oder lassen sich nach bekannten Verfahren herstellen.

25 25 Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (C) jeweils alle üblichen protischen Solventien in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind Wasser oder Alkohole, wie Methanol, Ethanol; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester. Besonders bevorzugt verwendet man Wasser oder Alkohole, ganz besonders bevorzugt Methanol oder Ethanol.

Als wasserabsorbierendes Reagenz kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (C) jeweils alle üblichen Dehydratisierungsreagenzien in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind Carbodiimide. Besonders bevorzugt verwendet man Dicyclohexylcarbodiimid (DCC) oder N-(3-Dimethylaminopropyl)-N'-ethyl-carbodiimid (EDC).

5 Als Base kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (C) alle für derartige Reaktionen üblichen anorganischen und organischen Basen in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind Erdalkali- oder Alkalimetallhydroxide, wie Natriumhydroxid, Calciumhydroxid, Kaliumhydroxid, oder auch Ammoniumhydroxid.

10 Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (C) jeweils in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen -20°C und 200°C, vorzugsweise zwischen 15 0°C und 150°C, ganz besonders bevorzugt zwischen 20°C und 100°C.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (C) wird im allgemeinen 1 Mol an Verbindung der Formel (I-c) in der ersten Stufe zunächst mit einer Base behandelt und in der zweiten Stufe mit 1 Mol oder einem leichten Überschuss an 20 Verbindung der Formel (VI), sowie 1-1.5 Mol% an wasserabsorbierendem Reagenz versetzt. Es ist jedoch auch möglich, die Reaktionskomponenten in anderen Verhältnissen einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen verfährt man in der Weise, dass man das Reaktionsgemisch einengt und das Rohprodukt nach üblichen Methoden, wie Chromatographie oder Umkristallisation, von eventuell vorhandenen Verunreinigungen befreit.

Verfahren (D)

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (D) als Ausgangsstoffe benötigten Pyridylpyrimidine sind durch die Formel (I-f) allgemein definiert. In dieser Formel stehen R¹, R², X, n, Z und R bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang

mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

5 Die Pyridylpyrimidine der Formel (I-f) fallen unter die Definition der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) und werden zum Beispiel nach einem der Verfahren (A) oder (B) hergestellt.

10 Als Oxidationsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (D) kommen alle üblichen zur Schwefeloxidation verwendbaren Oxidationsmittel infrage. Insbesondere geeignet sind Wasserstoffperoxid, organische Persäuren, wie beispielsweise Peressigsäure, m-Chlorperbenzoësäure, p-Nitroperbenzoësäure oder Luftsauerstoff.

15 Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (D) kommen ebenfalls inerte organische Lösungsmittel infrage. Vorzugsweise verwendet man Kohlenwasserstoffe, wie Benzin, Benzol, Toluol, Hexan oder Petrolether; chlorierte Kohlenwasserstoffe, wie Dichlormethan, 1,2-Dichlorethan, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff oder Chlorbenzol; Ether, wie Diethylether, Dioxan oder Tetrahydrofuran; Carbonsäuren, wie Essigsäure oder Propionsäure; oder dipolare aprotische Lösungsmittel, wie Acetonitril, Aceton, Essigsäureethylester oder Dimethylformamid.

25 Das erfindungsgemäße Verfahren (D) kann gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels durchgeführt werden. Als solche kommen alle üblicherweise verwendbaren organischen und anorganischen Säurebindemittel infrage. Vorzugsweise verwendet man Erdalkali- oder Alkalimetallhydroxide, -acetate oder -carbonate, wie beispielsweise Calciumhydroxid, Natriumhydroxid, Natriumacetat oder Natriumcarbonat.

30 Das erfindungsgemäße Verfahren (D) kann gegebenenfalls in Gegenwart eines geeigneten Katalysators durchgeführt werden. Als solche kommen alle üblicherweise für derartige Schwefeloxidationen gebräuchlichen Metallsalz-Katalysatoren infrage.

Beispielhaft genannt sei in diesem Zusammenhang Ammoniummolybdat und Natriumwolframat.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (D) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen -20°C und +70°C, vorzugsweise bei Temperaturen zwischen 0°C und +50°C.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (D) setzt man auf 1 Mol an Verbindung der Formel (I-f) im allgemeinen 0,8 bis 1,2 Mol, vorzugsweise äquimolare Mengen Oxidationsmittel ein, wenn man die Oxidation des Schwefels auf der Sulfoxidstufe unterbrechen will. Zur Oxidation zum Sulfon setzt man pro Mol an Verbindung der Formel (I-f) im allgemeinen 1,8 bis 3,0 Mol, vorzugsweise doppelt molare Mengen an Oxidationsmittel ein. Die Reaktionsdurchführung, Aufarbeitung und Isolierung der Endprodukte erfolgt nach üblichen Verfahren.

Verfahren (E)

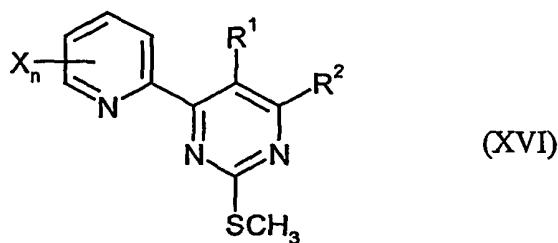
Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (E) als Ausgangsstoffe benötigten Methylsulfonylpyrimidine sind durch die Formel (VII) allgemein definiert. In dieser Formel stehen R¹, R², X und n bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

25

Die Methylsulfonylpyrimidine der Formel (VII) sind neu. Sie lassen sich herstellen, indem man

c) Methylthio-Derivate der Formel (XVI)

30



in welcher

R¹, R², X und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

5

mit einem Oxidationsmittel (z.B. m-Chlorperbenzoësäure) gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels (z.B. Dichlormethan) umsetzt.

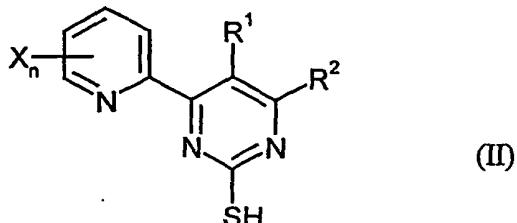
Die bei der Durchführung des Verfahrens (c) als Ausgangsstoffe benötigten Methylthio-Derivate sind durch die Formel (XVI) allgemein definiert. In dieser Formel steht R¹, R², X und n bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

10
15

Methylthio-Derivate der Formel (XVI) sind neu. Sie lassen sich herstellen, indem man

d) Thiole der Formel (II)

20



in welcher

R¹, R², X und n die oben angegebenen Bedeutungen haben

mit einem Methylierungsreagenz (z.B. Iodmethan) gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels (z.B. Acetonitril) und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels (z.B. Kaliumcarbonat) umsetzt.

5

Thiole der Formel (II) wurden bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung des erfindungsgemäßen Verfahrens (A) beschrieben.

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (E) als Ausgangsstoffe benötigten Amine sind durch die Formel (VIII) allgemein definiert. In dieser Formel stehen Z und R⁹ bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

15

Amine der Formel (VIII) sind bekannt und/oder lassen sich nach bekannten Verfahren herstellen.

Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (E) jeweils alle üblichen inerten, organischen Solventien in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester, Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid oder Sulfone, wie Sulfolan. Besonders bevorzugt verwendet man Nitrile, Amide oder Sulfoxide, ganz besonders bevorzugt Acetonitril, Dimethylformamid, Tetrahydrofuran oder Dimethylsulfoxid.

30

Als Basen kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (E) jeweils alle für derartige Reaktionen üblichen anorganischen und organischen Basen

in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind Erdalkali- oder Alkalimetallhydroxide, wie Natriumhydroxid, Calciumhydroxid, Kaliumhydroxid, oder auch Ammoniumhydroxid, Alkalimetallhydride, wie Natriumhydrid, Alkalimetallcarbonate, wie Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat, Natriumhydrogen-carbonat, Alkali- oder Erdalkalimetallacetate wie Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU). Besonders bevorzugt verwendet man Alkalimetallcarbonate oder -hydride, ganz besonders bevorzugt Kaliumcarbonat oder Natriumhydrid.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (E) jeweils in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen -20°C und 200°C, vorzugsweise zwischen 0°C und 150°C, ganz besonders bevorzugt zwischen 20°C und 100°C.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (E) setzt man auf 1 Mol an Verbindung der Formel (VII) im allgemeinen 1 Mol oder einen leichten Überschuss an Verbindung der Formel (VIII), sowie 0.1-5 Mol an Säurebindemittel ein. Es ist jedoch auch möglich, die Reaktionskomponenten in anderen Verhältnissen einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen verfährt man in der Weise, dass man das Reaktionsgemisch einengt, extrahiert, die organische Phase wäscht, trocknet, filtriert und eingeengt. Der Rückstand wird gegebenenfalls nach üblichen Methoden, wie Chromatographie oder Umkristallisation, von eventuell noch vorhandenen Verunreinigungen befreit.

Verfahren (F)

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (F) als Ausgangsstoffe benötigten Methylsulfonylpyrimidine der Formel (VII) wurden bereits bei der Durchführung des Verfahrens (E) beschrieben.

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (F) als Ausgangsstoffe benötigten Hydroxy-Verbindungen sind durch die Formel (IX) allgemein definiert. In dieser Formel steht Z bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

Hydroxy-Verbindungen der Formel (IX) sind bekannt und/oder lassen sich nach bekannten Verfahren herstellen.

10

Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (F) jeweils alle üblichen inerten, organischen Solventien in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid oder Sulfone, wie Sulfolan. Besonders bevorzugt verwendet man Nitrile, Amide oder Sulfoxide, ganz besonders bevorzugt Acetonitril, Dimethylformamid oder Dimethylsulfoxid.

20

Als Basen kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (F) jeweils alle für derartige Reaktionen üblichen anorganischen und organischen Basen in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind Erdalkali- oder Alkalimetallhydroxide, wie Natriumhydroxid, Calciumhydroxid, Kaliumhydroxid, oder auch Ammoniumhydroxid, Alkalimetallhydride, wie Natriumhydrid, Alkalimetallcarbonate, wie Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat, Natriumhydrogencarbonat, Alkali- oder Erdalkalimetallacetate wie Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU). Besonders bevorzugt verwendet man Alkalimetallcarbonate oder -hydride, ganz besonders bevorzugt Kaliumcarbonat oder Natriumhydrid.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (F) jeweils in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen -20°C und 200°C, vorzugsweise zwischen 5 0°C und 150°C, ganz besonders bevorzugt zwischen 20°C und 100°C.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (F) setzt man auf 1 Mol an 10 Verbindung der Formel (VII) im allgemeinen 1 Mol oder einen leichten Überschuss an Verbindung der Formel (IX), sowie 0.1-5 Mol an Säurebindemittel ein. Es ist jedoch auch möglich, die Reaktionskomponenten in anderen Verhältnissen einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen verfährt man in der Weise, dass man das Reaktionsgemisch einengt, extrahiert, die organische Phase wäscht, trocknet, filtriert und eingeengt. Der Rückstand wird gegebenenfalls 15 nach üblichen Methoden, wie Chromatographie oder Umkristallisation, von eventuell noch vorhandenen Verunreinigungen befreit.

Verfahren (G)

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (G) als Ausgangsstoffe 20 benötigten Pyridin-Derivate der Formeln (X) und (XI) wurden bereits bei der Durchführung des Verfahrens (A) beschrieben.

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (G) als Ausgangsstoffe benötigten Amidine sind durch die Formel (XII) allgemein definiert. In dieser Formel 25 steht Z bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

30 Amidine der Formel (XII) sind bekannt und/oder lassen sich nach bekannten Verfahren herstellen.

Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (G) jeweils alle üblichen protischen Solventien in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind Wasser oder Alkohole, wie Methanol, Ethanol; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester. Besonders bevorzugt verwendet man Wasser oder Alkohole, ganz besonders bevorzugt Methanol oder Ethanol.

Als Basen kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (G) jeweils alle für derartige Reaktionen üblichen anorganischen und organischen Basen in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind Erdalkali- oder Alkalimetallhydroxide, wie Natriumhydroxid, Calciumhydroxid, Kaliumhydroxid, oder auch Ammoniumhydroxid, Alkalimetallhydride, wie Natriumhydrid, Alkalimetallcarbonate, wie Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat, Natriumhydrogencarbonat, Alkali- oder Erdalkalimetallacetate wie Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Alkalimetallalkoholate wie Natriummethanolat, Natriummethanolat. Besonders bevorzugt verwendet man Alkalimetallalkoholate, ganz besonders bevorzugt Natriummethanolat.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (G) jeweils in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen –20°C und 200°C, vorzugsweise zwischen 0°C und 150°C, ganz besonders bevorzugt zwischen 20°C und 100°C.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (G) setzt man auf 1 Mol an Verbindung der Formel (X) oder (XI) im allgemeinen 1 Mol oder einen leichten Überschuss an Verbindung der Formel (XII), sowie 0.1-5 Mol an Säurebindemittel ein. Es ist jedoch auch möglich, die Reaktionskomponenten in anderen Verhältnissen einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen verfährt man in der Weise, dass man das Reaktionsgemisch einengt, extrahiert, die organische Phase wäscht, trocknet, filtriert und eingeengt. Der Rückstand wird gegebenenfalls nach üblichen Methoden, wie Chromatographie oder Umkristallisation, von eventuell noch vorhandenen Verunreinigungen befreit.

Verfahren (H)

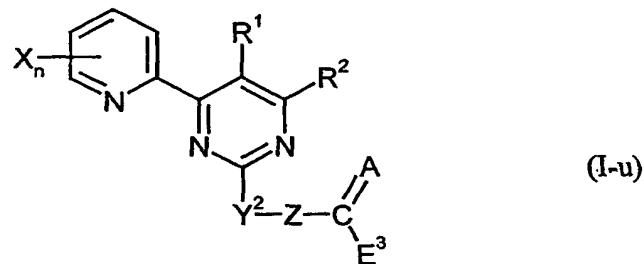
Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (H) als Ausgangsstoffe benötigten Pyridylpyrimidine sind durch die Formel (I-k) allgemein definiert. In dieser Formel stehen R¹, R², X, n, Z und A bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden. Y² steht bevorzugt für eine direkte Bindung, Schwefel, Sauerstoff oder NR⁹.

10

Pyridylpyrimidine der Formel (I-k) sind ebenfalls erfindungsgemäße Verbindungen, die sich zum Beispiel herstellen lassen, indem man

e) Ester der Formel (I-u)

15



in welcher

R¹, R², X, n, Y², A und E³ die oben angegebenen Bedeutungen haben,

20

mit einer Base (z.B. Natriumhydroxid) gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels (z.B. Methanol) behandelt.

25

Pyridylpyrimidine der Formel (I-u) sind ebenfalls Teil dieser Erfindung und können über Verfahren (A) oder (B) hergestellt werden.

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (H) als Ausgangsstoffe benötigten Hydroxide sind durch die Formel (XIII) allgemein definiert. In dieser Formel steht M bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

Hydroxide der Formel (XIII) sind bekannt und/oder lassen sich nach bekannten Verfahren herstellen.

10

Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (H) jeweils alle üblichen protischen Solventien in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind Wasser oder Alkohole, wie Methanol, Ethanol; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril. Besonders bevorzugt verwendet man Wasser oder Alkohole.

15

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (H) jeweils in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 200°C, vorzugsweise zwischen 0°C und 150°C, ganz besonders bevorzugt zwischen 20°C und 100°C.

20

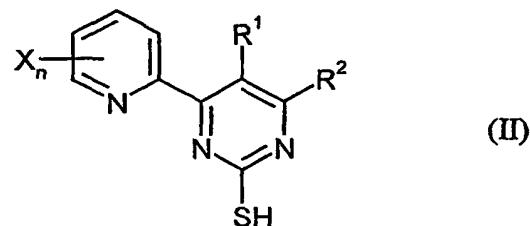
Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (H) setzt man auf 1 Mol an Verbindung der Formel (I-k) im allgemeinen 1 Mol oder einen leichten Überschuss an Verbindung der Formel (XIII) ein. Es ist jedoch auch möglich, die Reaktionskomponenten in anderen Verhältnissen einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen verfährt man in der Weise, dass man das Reaktionsgemisch einengt, extrahiert, die organische Phase wäscht, trocknet, filtriert und eingeengt. Der Rückstand wird gegebenenfalls nach üblichen Methoden, wie Chromatographie oder Umkristallisation, von eventuell noch vorhandenen Verunreinigungen befreit.

Verfahren (J)

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (J) als Ausgangsstoffe benötigten Nitrile sind durch die Formel (XIV) allgemein definiert. In dieser Formel 5 stehen R^1 , R^2 , X, n, Y und Z bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

10 Nitrile der Formel (XIV) sind neu. Sie lassen sich herstellen, indem man

f) Thiole der Formel (II)



15 --- in welcher

R^1 , R^2 , X und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit chlorierten Nitrilen der Formel (XVII)

20



in welcher

Z die oben angegebenen Bedeutungen hat,

25

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels (z.B. Toluol) und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels (z.B. Natriumhydroxid) umgesetzt.

Die bei der Durchführung des Verfahrens (f) als Ausgangsstoffe benötigten Verbindungen der Formel (II) wurden bereits bei der Beschreibung des erfindungsgemäßen Verfahrens (A) beschrieben.

- 5 Die bei der Durchführung des Verfahrens (f) als Ausgangsstoffe benötigten chlorierten Nitrile sind durch die Formel (XVII) allgemein definiert. In dieser Formel steht Z bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

Chlorierte Nitrile der Formel (XVII) sind bekannt.

- 15 Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (J) benötigten Trialkylzinnazide sind bekannt. Bevorzugt verwendet man Trimethylzinnazid oder Tri(n-butyl)zinnazid.

- 20 Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (J) jeweils alle üblichen inerten, organischen Solventien in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind gegebenenfalls halogenierte aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethyl-ester oder Essigsäureethylester; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid oder Sulfone, wie Sulfolan. Besonders bevorzugt verwendet man Toluol.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (J) setzt man auf 1 Mol an Verbindung der Formel (XIV) im allgemeinen 1 Mol oder einen leichten Überschuss eines Trialkylzinnazids ein. Es ist jedoch auch möglich, die Reaktionskomponenten in anderen Verhältnissen einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen verfährt man in der Weise, dass man das Reaktionsgemisch einengt, extrahiert, die organische Phase wäscht, trocknet, filtriert und eingeengt. Der Rückstand wird gegebenenfalls nach üblichen Methoden, wie Chromatographie oder Umkristallisation, von eventuell noch vorhandenen Verunreinigungen befreit.

10

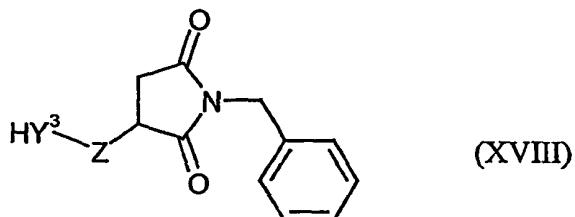
Verfahren (K)

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (K) als Ausgangsstoffe benötigten Pyridylpyrimidine sind durch die Formel (I-n) allgemein definiert. In dieser Formel stehen R¹, R², X, n und Z bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden. Y² steht bevorzugt für eine direkte Bindung, Schwefel, Sauerstoff oder NR⁹.

20

Pyridylpyrimidine der Formel (I-n) sind neu. Sie lassen sich herstellen, indem man

g) Verbindungen der Formel (XVIII)



25

in welcher

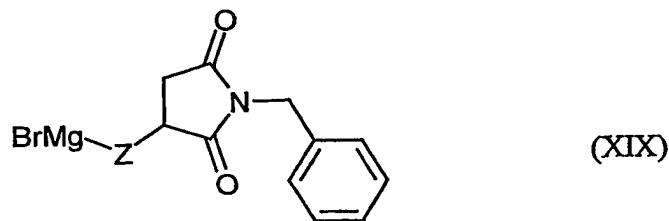
Z die oben angegebenen Bedeutungen hat,

Y^3 für Sauerstoff, Schwefel oder $-NR^9-$ steht, wobei R^9 die oben angegebenen Bedeutungen hat,

oder

5

Grignard-Verbindungen der Formel (XIX)

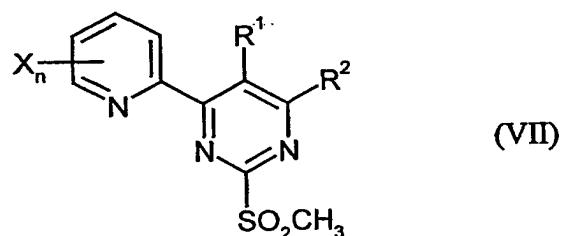


in welcher

10

Z die oben angegebenen Bedeutungen hat,

mit Methylsulfonylpyrimidinen der Formel (VII)



15

in welcher

R^1 , R^2 , X und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

20

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels (z.B. Tetrahydrofuran) und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels (z.B. Triethylamin) umsetzt.

Die bei der Durchführung des Verfahrens (g) als Ausgangsstoffe benötigten Verbindungen sind durch die Formeln (XVIII) und (XIX) allgemein definiert. In diesen Formeln steht Z bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

Verbindungen der Formel (XVIII) und Grignard-Verbindungen der Formel (XIX) lassen sich nach bekannten Verfahren herstellen.

10

Verbindungen der Formel (VII) wurden bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung des Verfahrens (E) beschrieben.

15

Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (K) jeweils alle üblichen inerten, organischen Solventien in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid oder Sulfone, wie Sulfolan. Besonders bevorzugt verwendet man Nitrile, Amide oder Sulfoxide, ganz besonders bevorzugt Acetonitril, Dimethylformamid, Tetrahydrofuran oder Dimethylsulfoxid.

20

25

Als Katalysator setzt man bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (K) alle für eine Hydrierungsreaktion üblichen Katalysatoren ein. Vorzugsweise verwendbar sind Palladium- oder Platin-Katalysatoren, besonders bevorzugt Palladium/Aktivkohle.

30

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (K) jeweils in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen

arbeitet man bei Temperaturen zwischen –20°C und 200°C, vorzugsweise zwischen 0°C und 150°C.

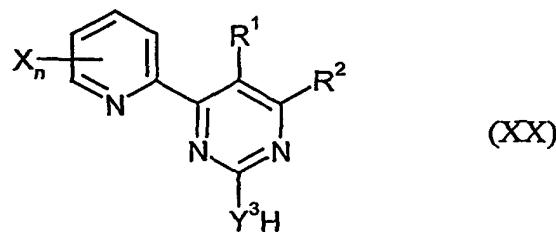
Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (K) setzt man auf 1 Mol an
 5 Verbindung der Formel (I-n) im allgemeinen 1-10 Mol% eines Katalysators ein. Es ist jedoch auch möglich, die Reaktionskomponenten in anderen Verhältnissen einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen verfährt man in der Weise, dass man das Reaktionsgemisch einengt, extrahiert, die organische Phase wäscht, trocknet, filtriert und eingeengt. Der Rückstand wird gegebenenfalls
 10 nach üblichen Methoden, wie Chromatographie oder Umkristallisation, von eventuell noch vorhandenen Verunreinigungen befreit.

Verfahren (L)

15 Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (L) als Ausgangsstoffe benötigten Keto-Verbindungen sind durch die Formel (XV) allgemein definiert. In dieser Formel stehen R¹, R², X, n und Z bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden. Y² steht bevorzugt für eine direkte Bindung, Schwefel, Sauerstoff oder NR⁹.
 20

Keto-Verbindungen der Formel (XV) sind neu. Sie lassen sich herstellen, indem man

25 h) Verbindungen der Formel (XX)

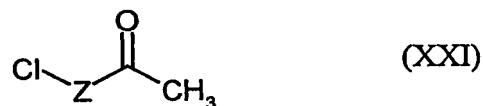


in welcher

R¹, R², X, n und Y³ die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Methylketonen der Formel (XXI)

5



in welcher

Z die oben angegebenen Bedeutungen hat,

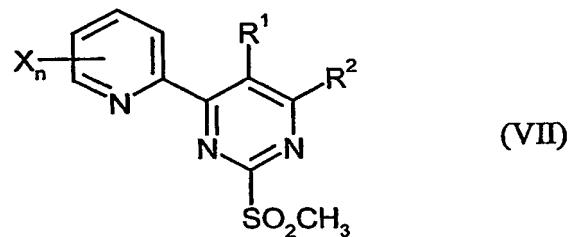
10

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels (z.B. Tetrahydrofuran) und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels (z.B. Triethylamin) umsetzt,

oder

15

i) Methylsulfonylpyrimidine der Formel (VII)

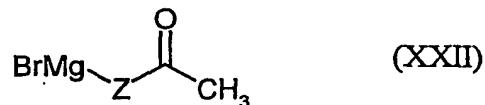


in welcher

20

R¹, R², X und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Grignard-Verbindungen der Formel (XXII)



in welcher

Z die oben angegebenen Bedeutungen hat,

5

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels (z.B. Tetrahydrofuran) und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindermittels (z.B. Triethylamin) umsetzt.

- 10 Die bei der Durchführung des Verfahrens (h) als Ausgangsstoffe benötigten Verbindungen sind durch die Formel (XX) allgemein definiert. In dieser Formel stehen R¹, R², X und n bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfundungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden. Y³ steht bevorzugt für Schwefel, Sauerstoff oder NR⁹.
- 15

Die Verbindungen der Formel (XX) sind teilweise bekannt und/oder lassen sich nach bekannte Verfahren herstellen.

- 20 Die bei der Durchführung des Verfahrens (h) als Ausgangsstoffe benötigten Methylketone sind durch die Formel (XXI) allgemein definiert. In dieser Formel steht Z bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfundungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.
- 25

Methylketone der Formel (XXI) sind bekannt.

Die bei der Durchführung des Verfahrens (i) als Ausgangsstoffe benötigten Methylsulfonylpyrimidine der Formel (VII) wurden bereits bei der Durchführung des Verfahrens (E) beschrieben.

- 5 Die bei der Durchführung des Verfahrens (i) als Ausgangsstoffe benötigten Grignard-Verbindungen sind durch die Formel (XXII) allgemein definiert. In dieser Formel steht Z bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.
- 10

Grignard-Verbindungen der Formel (XXII) sind bekannt.

- Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (L) jeweils alle üblichen inerten, organischen Solventien in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind gegebenenfalls halogenierte aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester, Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid oder Sulfone, wie Sulfolan.

- Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (L) setzt man auf 1 Mol an Verbindung der Formel (XV) im allgemeinen 1 Mol oder einen leichten Überschuss an Ammoniumcarbonat und 1 Mol oder einen leichten Überschuss an Kaliumcyanid ein. Es ist jedoch auch möglich, die Reaktionskomponenten in anderen Verhältnissen einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen ver-

fährt man in der Weise, dass man das Reaktionsgemisch einengt, extrahiert, die organische Phase wäscht, trocknet, filtriert und eingeengt. Der Rückstand wird gegebenenfalls nach üblichen Methoden, wie Chromatographie oder Umkristallisation, von eventuell noch vorhandenen Verunreinigungen befreit.

5

Bei der Durchführung aller erfindungsgemäßen Verfahren arbeitet man im allgemeinen unter Atmosphärendruck. Es ist aber auch möglich, jeweils unter erhöhtem oder verminderter Druck zu arbeiten.

10

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich bei guter Pflanzenverträglichkeit und günstiger Warmblütertoxizität zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen, insbesondere Insekten, Spinnentieren und Nematoden, die in der Landwirtschaft, in Forsten, im Vorrats- und Materialschutz sowie auf dem Hygiene sektor vorkommen. Sie können vorzugsweise als Pflanzenschutzmittel eingesetzt werden. Sie sind gegen normal sensible und resistente Arten sowie gegen alle oder einzelne Entwicklungsstadien wirksam. Zu den oben erwähnten Schädlingen gehören:

15

Aus der Ordnung der Isopoda z.B. *Oniscus asellus*, *Armadillidium vulgare*, *Porcellio scaber*.

20

Aus der Ordnung der Diplopoda z.B. *Blaniulus guttulatus*.

Aus der Ordnung der Chilopoda z.B. *Geophilus carpophagus*, *Scutigera spp.*

Aus der Ordnung der Symphyla z.B. *Scutigerella immaculata*.

Aus der Ordnung der Thysanura z.B. *Lepisma saccharina*.

Aus der Ordnung der Collembola z.B. *Onychiurus armatus*.

25

Aus der Ordnung der Orthoptera z.B. *Acheta domesticus*, *Gryllotalpa spp.*, *Locusta migratoria migratorioides*, *Melanoplus spp.*, *Schistocerca gregaria*.

Aus der Ordnung der Blattaria z.B. *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Leucophaea maderae*, *Blattella germanica*.

Aus der Ordnung der Dermaptera z.B. *Forficula auricularia*.

30

Aus der Ordnung der Isoptera z.B. *Reticulitermes spp.*

Aus der Ordnung der Phthiraptera z.B. *Pediculus humanus corporis*, *Haematopinus spp.*, *Linognathus spp.*, *Trichodectes spp.*, *Damalinia spp..*

Aus der Ordnung der Thysanoptera z.B. *Hercinothrips femoralis*, *Thrips tabaci*, *Thrips palmi*, *Frankliniella accidentalis*.

Aus der Ordnung der Heteroptera z.B. *Eurygaster spp.*, *Dysdercus intermedius*, *Piesma quadrata*, *Cimex lectularius*, *Rhodnius prolixus*, *Triatoma spp.*

5

Aus der Ordnung der Homoptera z.B. *Aleurodes brassicae*, *Bemisia tabaci*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Aphis gossypii*, *Brevicoryne brassicae*, *Cryptomyzus ribis*, *Aphis fabae*, *Aphis pomi*, *Eriosoma lanigerum*, *Hyalopterus arundinis*, *Phylloxera vastatrix*, *Pemphigus spp.*, *Macrosiphum avenae*, *Myzus spp.*, *Phorodon humuli*, *Rhopalosiphum padi*, *Empoasca spp.*, *Euscelis bilobatus*, *Nephrotettix cincticeps*, *Lecanium corni*, *Saissetia oleae*, *Laodelphax striatellus*, *Nilaparvata lugens*, *Aonidiella aurantii*, *Aspidiotus hederae*, *Pseudococcus spp.*, *Psylla spp.*

10

Aus der Ordnung der Lepidoptera z.B. *Pectinophora gossypiella*, *Bupalus piniarius*, *Cheimatobia brumata*, *Lithocolletis blancardella*, *Hyponomeuta padella*, *Plutella xylostella*, *Malacosoma neustria*, *Euproctis chrysorrhoea*, *Lymantria spp.*, *Bucculatrix thurberiella*, *Phylloconistis citrella*, *Agrotis spp.*, *Euxoa spp.*, *Feltia spp.*, *Earias insulana*, *Heliothis spp.*, *Mamestra brassicae*, *Panolis flammea*, *Spodoptera spp.*, *Trichoplusia ni*, *Carpocapsa pomonella*, *Pieris spp.*, *Chilo spp.*, *Pyrausta nubilalis*, *Ephestia kuehniella*, *Galleria mellonella*, *Tineola bisselliella*, *Tinea pellionella*, *Hofmannophila pseudospretella*, *Cacoecia podana*, *Capua reticulana*, *Choristoneura fumiferana*, *Clytia ambiguella*, *Homona magnanima*, *Tortrix viridana*, *Cnaphalocerus spp.*, *Oulema oryzae*.

20

25

Aus der Ordnung der Coleoptera z.B. *Anobium punctatum*, *Rhizopertha dominica*, *Bruchidius obtectus*, *Acanthoscelides obtectus*, *Hylotrupes bajulus*, *Agelastica alni*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Phaedon cochleariae*, *Diabrotica spp.*, *Psylliodes chrysoccephala*, *Epilachna varivestis*, *Atomaria spp.*, *Oryzaephilus surinamensis*, *Anthonomus spp.*, *Sitophilus spp.*, *Otiorrhynchus sulcatus*, *Cosmopolites sordidus*, *Ceuthorrhynchus assimilis*, *Hypera postica*, *Dermestes spp.*, *Trogoderma spp.*, *Anthrenus spp.*, *Attagenus spp.*, *Lyctus spp.*, *Meligethes aeneus*, *Ptinus spp.*, *Niptus hololeucus*, *Gibbium psylloides*, *Tribolium spp.*, *Tenebrio molitor*, *Agriotes spp.*

30

Conoderus spp., Melolontha melolontha, Amphimallon solstitialis, Costelytra zealandica, Lissorhoptrus oryzophilus.

5 Aus der Ordnung der Hymenoptera z.B. Diprion spp., Hoplocampa spp., Lasius spp., Monomorium pharaonis, Vespa spp.

Aus der Ordnung der Diptera z.B. Aedes spp., Anopheles spp., Culex spp., Drosophila melanogaster, Musca spp., Fannia spp., Calliphora erythrocephala, Lucilia spp., Chrysomyia spp., Cuterebra spp., Gastrophilus spp., Hyppobosca spp., Stomoxys spp., Oestrus spp., Hypoderma spp., Tabanus spp., Tannia spp., Bibio hortulanus, Oscinella frit, Phorbia spp., Pegomyia hyoscyami, Ceratitis capitata, Dacus oleae, Tipula paludosa, Hylemyia spp., Liriomyza spp..

15 Aus der Ordnung der Siphonaptera z.B. Xenopsylla cheopis, Ceratophyllus spp..

Aus der Klasse der Arachnida z.B. Scorpio maurus, Latrodectus mactans, Acarus siro, Argas spp., Ornithodoros spp., Dermacentor gallinae, Eriophyes ribis, Phyllocoptes oleivora, Boophilus spp., Rhipicephalus spp., Amblyomma spp., Hyalomma spp., Ixodes spp., Psoroptes spp., Chorioptes spp.; Sarcoptes spp., Tarsonemus spp., Bryobia praetiosa, Panonychus spp., Tetranychus spp., Hemitarsonemus spp., Brevipalpus spp..

25 Zu den pflanzenparasitären Nematoden gehören z.B. Pratylenchus spp., Radopholus similis, Ditylenchus dipsaci, Tylenchulus semipenetrans, Heterodera spp., Globodera spp., Meloidogyne spp., Aphelenchoides spp., Longidorus spp., Xiphinema spp., Trichodorus spp., Bursaphelenchus spp..

30 Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) zeichnen sich insbesondere durch eine hervorragende Wirkung gegen Raupen, Käferlarven, Spinnmilben, Blattläuse und Minierfliegen aus.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen können gegebenenfalls in bestimmten Konzentrationen bzw. Aufwandmengen auch als Herbizide und Mikrobiocide, beispielsweise als Fungizide, Antimykotika und Bakterizide verwendet werden. Sie lassen sich gegebenenfalls auch als Zwischen- oder Vorprodukte für die Synthese weiterer Wirkstoffe einsetzen.

Erfindungsgemäß können alle Pflanzen und Pflanzenteile behandelt werden. Unter Pflanzen werden hierbei alle Pflanzen und Pflanzenpopulationen verstanden, wie erwünschte und unerwünschte Wildpflanzen oder Kulturpflanzen (einschließlich natürlich vorkommender Kulturpflanzen). Kulturpflanzen können Pflanzen sein, die durch konventionelle Züchtungs- und Optimierungsmethoden oder durch biotechnologische und gentechnologische Methoden oder Kombinationen dieser Methoden erhalten werden können, einschließlich der transgenen Pflanzen und einschließlich der durch Sortenschutzrechte schützbaren oder nicht schützbaren Pflanzensorten.

Unter Pflanzenteilen sollen alle oberirdischen und unterirdischen Teile und Organe der Pflanzen, wie Sproß, Blatt, Blüte und Wurzel verstanden werden, wobei beispielhaft Blätter, Nadeln, Stengel, Stämme, Blüten, Fruchtkörper, Früchte und Samen sowie Wurzeln, Knollen und Rhizome aufgeführt werden. Zu den Pflanzenteilen gehört auch Erntegut sowie vegetatives und generatives Vermehrungsmaterial, beispielsweise Stecklinge, Knollen, Rhizome, Ableger und Samen.

Die erfindungsgemäße Behandlung der Pflanzen und Pflanzenteile mit den Wirkstoffen erfolgt direkt oder durch Einwirkung auf deren Umgebung, Lebensraum oder Lagerraum nach den üblichen Behandlungsmethoden, z.B. durch Tauchen, Sprühen, Verdampfen, Vernebeln, Streuen, Aufstreichen und bei Vermehrungsmaterial, insbesondere bei Samen, weiterhin durch ein- oder mehrschichtiges Umhüllen.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können in die üblichen Formulierungen überführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Spritzpulver, Suspensionen, Pulver, Stäubemittel, Pasten, lösliche Pulver, Granulate, Suspensions-Emulsions-Konzentrate, Wirkstoff-imprägnierte Natur- und synthetische Stoffe sowie Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen.

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Vermischen der erfindungsgemäßen Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaumerzeugenden Mitteln.

Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylol, Toluol, oder Alkylnaphthaline, chlorierte Aromaten und chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylen oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfraktionen, mineralische und pflanzliche Öle, Alkohole, wie Butanol oder Glykol sowie deren Ether und Ester, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser.

Als feste Trägerstoffe kommen in Frage:

z.B. Ammoniumsalze und natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talcum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate, als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnusschalen, Maiskolben und Tabakstengeln;

als Emulgier- und/oder schaumerzeugende Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäure-Ester, Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, z.B. Alkylaryl-polyglykolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Einweißhydrolysate;

als Dispergiermittel kommen in Frage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche
5 und synthetische pulvrige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden,
wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide,
wie Kephaline und Lecithine und synthetische Phospholipide. Weitere Additive
können mineralische und vegetabile Öle sein.

10 Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyaninfarbstoffe und Spurennährstoffe wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

15 Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können in handelsüblichen Formulierungen sowie in den aus diesen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen in Mischung mit anderen Wirkstoffen, wie Insektiziden, Lockstoffen, Sterilantien, Bakteriziden, Akariziden, Nematiziden, Fungiziden, wachstumsregulierenden Stoffen oder Herbiziden vorliegen. Zu den Insektiziden zählen beispielsweise Phosphorsäureester, Carbamate, Carbonsäureester, chlorierte Kohlenwasserstoffe, Phenylharnstoffe, durch Mikroorganismen hergestellte Stoffe u.a.

25 Besonders günstige Mischpartner sind z.B. die folgenden:

Fungizide:

Aldimorph, Ampropylfos, Ampropylfos-Kalium, Andoprim, Anilazin, Azaconazol,
30 Azoxystrobin, Benalaxyl, Benodanil, Benomyl, Benzamacril, Benzamacryl-isobutyl, Bialaphos, Binapacryl, Biphenyl, Bitertanol, Blasticidin-S, Bromuconazol, Bupirimat, Buthiobat,

- Calciumpolysulfid, Capsimycin, Captafol, Captan, Carbendazim, Carboxin, Carvon, Chinomethionat (Quinomethionat), Chlobenthiazon, Chlorfenazol, Chloroneb, Chloropicrin, Chlorothalonil, Chlozolinat, Clozylacon, Cufraneb, Cymoxanil, Cyproconazol, Cyprodinil, Cyprofuram,
- 5 Debacarb, Dichlorophen, Diclobutrazol, Diclofluanid, Diclomezin, Dicloran, Diethofencarb, Difenoconazol, Dimethirimol, Dimethomorph, Diniconazol, Diniconazol-M, Dinocap, Diphenylamin, Dipyridithione, Ditalimfos, Dithianon, Dodemorph, Dodine, Drazoxolon,
- 10 Ediphenphos, Epoxiconazol, Etaconazol, Ethirimol, Etridiazol,
- 10 Famoxadon, Fenapanil, Fenarimol, Fenbuconazol, Fenfuram, Fenitropan, Fenpiclonil, Fenpropidin, Fenpropimorph, Fentinacetat, Fenthydroxyd, Ferbam, Ferimzon, Fluanzinam, Flumetover, Fluoromid, Fluquinconazol, Flurprimidol, Flusilazol, Flusulfamid, Flutolanil, Flutriafol, Folpet, Fosetyl-Alminium, Fosetyl-Natrium, Fthalid, Fuberidazol, Furalaxyl, Furametpyr, Furcarbonil, Furconazol, Furconazol-cis, Furmecyclox, Guazatin, Hexachlorobenzol, Hexaconazol, Hymexazol,
- 15 Imazalil, Imibenconazol, Iminoctadin, Iminoctadinealbesilat, Iminoctadinetriacetat, Iodocarb, Ipconazol, Iprobenfos (IBP), Iprodione, Irumamycin, Isoprothiolan, Isovalendione,
- 15 Kasugamycin, Kresoxim-methyl, Kupfer-Zubereitungen, wie: Kupferhydroxid, Kupfernaphthenat, Kupferoxychlorid, Kupfersulfat, Kupferoxid, Oxin-Kupfer und Bordeaux-Mischung,
- 20 Mancopper, Mancozeb, Maneb, Meferimzone, Mepanipyrim, Mepronil, Metalaxyl, Metconazol, Methasulfocarb, Methfuroxam, Metiram, Metomeclam, Metsulfovax, Mildiomycin, Myclobutanil, Myclozolin,
- 25 Nickel-dimethyldithiocarbamat, Nitrothal-isopropyl, Nuarimol, Ofurace, Oxadixyl, Oxamocarb, Oxolinicacid, Oxycarboxim, Oxyfenthiin, Paclbutrazol, Pefurazoat, Penconazol, Pencycuron, Phosdiphen, Pimaricin, Piperalin, Polyoxin, Polyoxorim, Probenazol, Prochloraz, Procymidon, Propamocarb, Propanosine-Natrium, Propiconazol, Propineb, Pyrazophos, Pyrifenoxy, Pyrimethanil, Pyroquilon, Pyroxyfur,
- 30 Quinconazol, Quintozan (PCNB), Schwefel und Schwefel-Zubereitungen,

Tebuconazol, Tecloftalam, Tecnazen, Tetcyclacis, Tetraconazol, Thiabendazol, Thicyofen, Thifluzamide, Thiophanate-methyl, Thiram, Tioxymid, Tolclofos-methyl, Tolyfluanid, Triadimefon, Triadimenol, Triazbutil, Triazoxid, Trichlamid, Tricyclazol, Tridemorph, Triflumizol, Triforin, Triticonazol,

5 Uniconazol,
Validamycin A, Vinclozolin, Viniconazol,
Zarilamid, Zineb, Ziram sowie
Dagger G, OK-8705, OK-8801,
 α -(1,1-Dimethylethyl)- β -(2-phenoxyethyl)-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,

10 α -(2,4-Dichlorphenyl)- β -fluor- β -propyl-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,
 α -(2,4-Dichlorphenyl)- β -methoxy- α -methyl-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,
 α -(5-Methyl-1,3-dioxan-5-yl)- β -[[4-(trifluormethyl)-phenyl]-methylen]-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,
(5RS,6RS)-6-Hydroxy-2,2,7,7-tetramethyl-5-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-3-octanon,

15 (E)- α -(Methoxyimino)-N-methyl-2-phenoxy-phenylacetamid,
{2-Methyl-1-[[[1-(4-methylphenyl)-ethyl]-amino]-carbonyl]-propyl}-carbaminsäure-1-isopropylester
1-(2,4-Dichlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-ethanon-O-(phenylmethyl)-oxim,
1-(2-Methyl-1-naphthalenyl)-1H-pyrrol-2,5-dion,

20 1-(3,5-Dichlorphenyl)-3-(2-propenyl)-2,5-pyrrolidindion,
1-[(Diiodmethyl)-sulfonyl]-4-methyl-benzol,
1-[[2-(2,4-Dichlorphenyl)-1,3-dioxolan-2-yl]-methyl]-1H-imidazol,
1-[[2-(4-Chlorphenyl)-3-phenyloxiranyl]-methyl]-1H-1,2,4-triazol,
1-[1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)-methoxy]-phenyl]-ethenyl]-1H-imidazol,

25 1-Methyl-5-nonyl-2-(phenylmethyl)-3-pyrrolidinol,
2',6'-Dibrom-2-methyl-4'-trifluormethoxy-4'-trifluor-methyl-1,3-thiazol-5-carboxanilid,
2,2-Dichlor-N-[1-(4-chlorphenyl)-ethyl]-1-ethyl-3-methyl-cyclopropancarboxamid,
2,6-Dichlor-5-(methylthio)-4-pyrimidinyl-thiocyanat,
2,6-Dichlor-N-(4-trifluormethylbenzyl)-benzamid,

30 2,6-Dichlor-N-[[4-(trifluormethyl)-phenyl]-methyl]-benzamid,
2-(2,3,3-Triiod-2-propenyl)-2H-tetrazol,
2-[(1-Methylethyl)-sulfonyl]-5-(trichlormethyl)-1,3,4-thiadiazol,

- 2-[[6-Deoxy-4-O-(4-O-methyl- β -D-glycopyranosyl)- α -D-glucopyranosyl]-amino]-4-methoxy-1H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-5-carbonitril,
 2-Aminobutan,
 2-Brom-2-(brommethyl)-pentandinitril,
 5 2-Chlor-N-(2,3-dihydro-1,1,3-trimethyl-1H-inden-4-yl)-3-pyridincarboxamid,
 2-Chlor-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(isothiocyanatomethyl)-acetamid,
 2-Phenylphenol(OPP),
 3,4-Dichlor-1-[4-(difluormethoxy)-phenyl]-1H-pyrrol-2,5-dion,
 3,5-Dichlor-N-[cyan[(1-methyl-2-propynyl)-oxy]-methyl]-benzamid,
 10 3-(1,1-Dimethylpropyl-1-oxo-1H-inden-2-carbonitril,
 3-[2-(4-Chlorophenyl)-5-ethoxy-3-isoxazolidinyl]-pyridin,
 4-Chlor-2-cyan-N,N-dimethyl-5-(4-methylphenyl)-1H-imidazol-1-sulfonamid,
 4-Methyl-tetrazolo[1,5-a]quinazolin-5(4H)-on,
 8-(1,1-Dimethylethyl)-N-ethyl-N-propyl-1,4-dioxaspiro[4.5]decan-2-methanamin,
 15 8-Hydroxychinolinsulfat,
 9H-Xanthen-9-carbonsäure-2-[(phenylamino)-carbonyl]-hydrazid,
 bis-(1-Methylethyl)-3-methyl-4-[(3-methylbenzoyl)-oxy]-2,5-thiophendicarboxylat,
 cis-1-(4-Chlorophenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-cycloheptanol,
 cis-4-[3-[4-(1,1-Dimethylpropyl)-phenyl-2-methylpropyl]-2,6-dimethyl-morpholin-
 20 hydrochlorid,
 Ethyl-[(4-chlorophenyl)-azo]-cyanoacetat,
 Kaliumhydrogencarbonat,
 Methantetrathiol-Natriumsalz,
 Methyl-1-(2,3-dihydro-2,2-dimethyl-1H-inden-1-yl)-1H-imidazol-5-carboxylat,
 25 Methyl-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(5-isoxazolylcarbonyl)-DL-alaninat,
 Methyl-N-(chloracetyl)-N-(2,6-dimethylphenyl)-DL-alaninat,
 N-(2,3-Dichlor-4-hydroxyphenyl)-1-methyl-cyclohexancarboxamid.
 N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-methoxy-N-(tetrahydro-2-oxo-3-furanyl)-acetamid,
 N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-methoxy-N-(tetrahydro-2-oxo-3-thienyl)-acetamid,
 30 N-(2-Chlor-4-nitrophenyl)-4-methyl-3-nitro-benzolsulfonamid,
 N-(4-Cyclohexylphenyl)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pyrimidinamin,
 N-(4-Hexylphenyl)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pyrimidinamin,

- N-(5-Chlor-2-methylphenyl)-2-methoxy-N-(2-oxo-3-oxazolidinyl)-acetamid,
N-(6-Methoxy)-3-pyridinyl)-cyclopropancarboxamid,
N-[2,2,2-Trichlor-1-[(chloracetyl)-amino]-ethyl]-benzamid,
N-[3-Chlor-4,5-bis-(2-propinyloxy)-phenyl]-N'-methoxy-methanimidamid,
- 5 N-Formyl-N-hydroxy-DL-alanin -Natriumsalz,
O,O-Diethyl-[2-(dipropylamino)-2-oxoethyl]-ethylphosphoramidothioat,
O-Methyl-S-phenyl-phenylpropylphosphoramidothioate,
S-Methyl-1,2,3-benzothiadiazol-7-carbothioat,
spiro[2H]-1-Benzopyran-2,1'(3'H)-isobenzofuran]-3'-on,
- 10
- Bakterizide:**
- Bronopol, Dichlorophen, Nitrapyrin, Nickel-Dimethyldithiocarbamat, Kasugamycin, Octhilinon, Furancarbonsäure, Oxytetracyclin, Probenazol, Streptomycin, Tecloftalam, Kupfersulfat und andere Kupfer-Zubereitungen.
- 15
- Insektizide / Akarizide / Nematizide:**
- Abamectin, Acephate, Acetamiprid, Acrinathrin, Alanycarb, Aldicarb, Aldoxycarb, Alpha-cypermethrin, Alphamethrin, Amitraz, Avermectin, AZ 60541, Azadirachtin, Azamethiphos, Azinphos A, Azinphos M, Azocyclotin,
- 20 Bacillus popilliae, Bacillus sphaericus, Bacillus subtilis, Bacillus thuringiensis, Baculoviren, Beauveria bassiana, Beauveria tenella, Bendiocarb, Benfuracarb, Bensultap, Benzoximate, Betacyfluthrin, Bifenazate, Bifenthrin, Bioethanomethrin, Biopermethrin, BPMC, Bromophos A, Bufencarb, Buprofezin, Butathiofos, Butocarboxim, Butylpyridaben,
- 25 Cadusafos, Carbaryl, Carbofuran, Carbophenothion, Carbosulfan, Cartap, Chlotho-carb, Chlorethoxyfos, Chlorfenapyr, Chlorfenvinphos, Chlorfluazuron, Chlormephos, Chlorpyrifos, Chlorpyrifos M, Chlovaporthrin, Cis-Resmethrin, Cispermethrin, Clopythrin, Cloethocarb, Clofentezine, Cyanophos, Cyclopene, Cycloprothrin, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cyhexatin, Cypermethrin, Cyromazine,
- 30 Deltamethrin, Demeton M, Demeton S, Demeton-S-methyl, Diafenthiuron, Diazinon, Dichlorvos, Diflubenzuron, Dimethoat, Dimethylvinphos, Diofenolan, Disulfoton, Docusat-sodium, Dofenapyn,

Eflusilanate, Emamectin, Empenthrin, Endosulfan, Entomopthora spp., Eprinomectin, Esfenvalerate, Ethiofencarb, Ethion, Ethoprophos, Etufenprox, Etoxazole, Etrimfos,

5 Fenamiphos, Fenazaquin, Fenbutatin oxide, Fenitrothion, Fenothiocarb, Fenoxacrim, Fenoxycarb, Fenpropothrin, Fenpyrad, Fenpyrithrin, Fenpyroximate, Fenvalerate, Fipronil, Fluazuron, Flubrocyclinate, Flucycloxuron, Flucythrinate, Flufenoxuron, Flutenzine, Fluvalinate, Fonophos, Fosmethilan, Fosthiazate, Fubfenprox, Furathiocarb,

10 Granuloseviren

10 Halofenozide, HCH, Heptenophos, Hexaflumuron, Hexythiazox, Hydroprene, Imidacloprid, Isazofos, Isofenphos, Isoxathion, Ivermectin, Kerpolyederviren

15 Lambda-cyhalothrin, Lufenuron

15 Malathion, Mecarbam, Metaldehyd, Methamidophos, Metharhizium anisopliae, Metharhizium flavoviride, Methidathion, Methiocarb, Methomyl, Methoxyfenozide, Metolcarb, Metoxadiazone, Mevinphos, Milbemectin, Monocrotophos, Naled, Nitenpyram, Nithiazine, Novaluron

20 Omethoat, Oxamyl, Oxydemethon M

20 Paecilomyces fumosoroseus, Parathion A, Parathion M, Permethrin, Phenthroate, Phorat, Phosalone, Phosmet, Phosphamidon, Phoxim, Pirimicarb, Pirimiphos A, Pirimiphos M, Profenofos, Promecarb, Propoxur, Prothiofos, Prothoat, Pymetrozine, Pyraclofos, Pyresmethrin, Pyrethrum, Pyridaben, Pyridathion, Pyrimidifen, Pyriproxyfen,

25 Quinalphos,

25 Ribavirin

25 Salithion, Sebufos, Selamectin, Silafluofen, Spinosad, Sulfotep, Sulprofos, Tau-fluvalinate, Tebufenozide, Tebufenpyrad, Tebupirimiphos, Teflubenzuron, Tefluthrin, Temephos, Temivinphos, Terbufos, Tetrachlorvinphos, Theta-cypermethrin, Thiamethoxam, Thiapronil, Thiatriphos, Thiocyclam hydrogen oxalate, 30 Thiodicarb, Thiofanox, Thuringiensin, Tralocythrin, Tralomethrin, Triarathene, Triazamate, Triazophos, Triazuron, Trichlophenidine, Trichlorfon, Triflumuron, Trimethacarb,

- Vamidothion, Vaniliprole, Verticillium lecanii
YI 5302
Zeta-cypermethrin, Zolaprofos
(1R-cis)-[5-(Phenylmethyl)-3-furanyl]-methyl-3-[(dihydro-2-oxo-3(2H)-furanylidene)-
5 methyl]-2,2-dimethylcyclopropancarboxylat
(3-Phenoxyphenyl)-methyl-2,2,3,3-tetramethylcyclopropanecarboxylat
1-[(2-Chlor-5-thiazolyl)methyl]tetrahydro-3,5-dimethyl-N-nitro-1,3,5-triazin-2(1H)-
imin
2-(2-Chlor-6-fluorophenyl)-4-[4-(1,1-dimethylethyl)phenyl]-4,5-dihydro-oxazol
10 2-(Acetlyoxy)-3-dodecyl-1,4-naphthalindion
2-Chlor-N-[[[4-(1-phenylethoxy)-phenyl]-amino]-carbonyl]-benzamid
2-Chlor-N-[[[4-(2,2-dichlor-1,1-difluorethoxy)-phenyl]-amino]-carbonyl]-benzamid
3-Methylphenyl-propylcarbamat
4-[4-(4-Ethoxyphenyl)-4-methylpentyl]-1-fluor-2-phenoxy-benzol
15 4-Chlor-2-(1,1-dimethylethyl)-5-[[2-(2,6-dimethyl-4-phenoxyphenoxy)ethyl]thio]-
3(2H)-pyridazinon
4-Chlor-2-(2-chlor-2-methylpropyl)-5-[(6-iod-3-pyridinyl)methoxy]-3(2H)-pyrida-
zinon
4-Chlor-5-[(6-chlor-3-pyridinyl)methoxy]-2-(3,4-dichlorphenyl)-3(2H)-pyridazinon
20 Bacillus thuringiensis strain EG-2348
Benzoesäure [2-benzoyl-1-(1,1-dimethylethyl)-hydrazid
Butansäure 2,2-dimethyl-3-(2,4-dichlorphenyl)-2-oxo-1-oxaspiro[4.5]dec-3-en-4-yl-
ester
[3-[(6-Chlor-3-pyridinyl)methyl]-2-thiazolidinyliden]-cyanamid
25 Dihydro-2-(nitromethylen)-2H-1,3-thiazine-3(4H)-carboxaldehyd
Ethyl-[2-[[1,6-dihydro-6-oxo-1-(phenylmethyl)-4-pyridazinyl]oxy]ethyl]-carbamat
N-(3,4,4-Trifluor-1-oxo-3-butenyl)-glycin
N-(4-Chlorphenyl)-3-[4-(difluormethoxy)phenyl]-4,5-dihydro-4-phenyl-1H-pyrazol-
1-carboxamid
30 N-[(2-Chlor-5-thiazolyl)methyl]-N'-methyl-N"-nitro-guanidin
N-Methyl-N'-(1-methyl-2-propenyl)-1,2-hydrazindicarbothioamid
N-Methyl-N'-2-propenyl-1,2-hydrazindicarbothioamid

O,O-Diethyl-[2-(dipropylamino)-2-oxoethyl]-ethylphosphoramidothioat

Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Herbiziden oder mit Düngemitteln und Wachstumsregulatoren ist möglich.

5

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können ferner beim Einsatz als Insektizide in ihren handelsüblichen Formulierungen sowie in den aus diesen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen in Mischung mit Synergisten vorliegen. Synergisten sind Verbindungen, durch die die Wirkung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gesteigert wird, ohne dass der zugesetzte Synergist selbst aktiv wirksam sein muss.

10

Der Wirkstoffgehalt der aus den handelsüblichen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen kann in weiten Bereichen variieren. Die Wirkstoffkonzentration der Anwendungsformen kann von 0,0000001 bis zu 95 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,0001 und 1 Gew.-% liegen.

15

Die Anwendung geschieht in einer den Anwendungsformen angepassten üblichen Weise.

20

Bei der Anwendung gegen Hygiene- und Vorratsschädlinge zeichnet sich der Wirkstoff durch eine hervorragende Residualwirkung auf Holz und Ton sowie durch eine gute Alkalistabilität auf gekälkten Unterlagen aus.

25

Wie bereits oben erwähnt, können erfindungsgemäß alle Pflanzen und deren Teile behandelt werden. In einer bevorzugten Ausführungsform werden wild vorkommende oder durch konventionelle biologische Zuchtmethoden, wie Kreuzung oder Protoplastenfusion erhaltenen Pflanzenarten und Pflanzensorten sowie deren Teile behandelt. In einer weiteren bevorzugten Ausführungsform werden transgene Pflanzen und Pflanzensorten, die durch gentechnologische Methoden gegebenenfalls in Kombination mit konventionellen Methoden erhalten wurden (Genetic Modified Organisms) und deren Teile behandelt. Der Begriff „Teile“ bzw. „Teile von Pflanzen“ oder „Pflanzenteile“ wurde oben erläutert.

30

Besonders bevorzugt werden erfindungsgemäß Pflanzen der jeweils handelsüblichen oder in Gebrauch befindlichen Pflanzensorten behandelt. Unter Pflanzensorten versteht man Pflanzen mit bestimmten Eigenschaften („Traits“), die sowohl durch konventionelle Züchtung, durch Mutagenese oder durch rekombinante DNA-Techniken erhalten worden sind. Dies können Sorten, Bio- und Genotypen sein.

5

10

15

20

25

30

Je nach Pflanzenarten bzw. Pflanzensorten, deren Standort und Wachstumsbedingungen (Böden, Klima, Vegetationsperiode, Ernährung) können durch die erfindungsgemäße Behandlung auch über additive („synergistische“) Effekte auftreten. So sind beispielsweise erniedrigte Aufwandmengen und/oder Erweiterungen des Wirkungsspektrums und/oder eine Verstärkung der Wirkung der erfindungsgemäß verwendbaren Stoffe und Mittel, besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte möglich, die über die eigentlich zu erwartenden Effekte hinausgehen.

Zu den bevorzugten erfindungsgemäß zu behandelnden transgenen (gentecnologisch erhaltenen) Pflanzen bzw. Pflanzensorten gehören alle Pflanzen, die durch die gentecnologische Modifikation genetisches Material erhielten, welches diesen Pflanzen besondere vorteilhafte wertvolle Eigenschaften („Traits“) verleiht. Beispiele für solche Eigenschaften sind besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte. Weitere und besonders hervorgehobene Beispiele für solche Eigenschaften sind eine erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen tierische und mikrobielle Schädlinge, wie gegenüber Insekten, Milben, pflanzenpathogenen Pilzen, Bakterien und/oder Viren sowie eine erhöhte Toleranz der Pflanzen gegen bestimmte

herbizide Wirkstoffe. Als Beispiele transgener Pflanzen werden die wichtigen Kulturpflanzen, wie Getreide (Weizen, Reis), Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle, Raps sowie Obstpflanzen (mit den Früchten Äpfel, Birnen, Zitrusfrüchten und Weintrauben) erwähnt, wobei Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle und Raps besonders hervorgehoben werden. Als Eigenschaften („Traits“) werden besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen Insekten durch in den Pflanzen entstehende Toxine, insbesondere solche, die durch das genetische Material aus *Bacillus thuringiensis* (z.B. durch die Gene CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIa, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb und CryIF sowie deren Kombinationen) in den Pflanzen erzeugt werden (im folgenden „Bt Pflanzen“). Als Eigenschaften („Traits“) werden auch besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr von Pflanzen gegen Pilze, Bakterien und Viren durch Systemische Akquirierte Resistenz (SAR), Systemin, Phytoalexine, Elicitoren sowie Resistenzgene und entsprechend exprimierte Proteine und Toxine. Als Eigenschaften („Traits“) werden weiterhin besonders hervorgehoben die erhöhte Toleranz der Pflanzen gegenüber bestimmten herbiziden Wirkstoffen, beispielsweise Imidazolinonen, Sulfonylharnstoffen, Glyphosate oder Phosphinotricin (z.B. „PAT“-Gen). Die jeweils die gewünschten Eigenschaften („Traits“) verleihenden Gene können auch in Kombinationen miteinander in den transgenen Pflanzen vorkommen. Als Beispiele für „Bt Pflanzen“ seien Maissorten, Baumwollsorten, Sojasorten und Kartoffelsorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen YIELD GARD® (z.B. Mais, Baumwolle, Soja), KnockOut® (z.B. Mais), StarLink® (z.B. Mais), Bollgard® (Baumwolle), Nucotn® (Baumwolle) und NewLeaf® (Kartoffel) vertrieben werden. Als Beispiele für Herbizid tolerante Pflanzen seien Maissorten, Baumwollsorten und Sojasorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen Roundup Ready® (Toleranz gegen Glyphosate z.B. Mais, Baumwolle, Soja), Liberty Link® (Toleranz gegen Phosphinotricin, z.B. Raps), IMI® (Toleranz gegen Imidazolinone) und STS® (Toleranz gegen Sulfonylharnstoffe z.B. Mais) vertrieben werden. Als Herbizid resistente (konventionell auf Herbizid-Toleranz gezüchtete) Pflanzen seien auch die unter der Bezeichnung Clearfield® vertriebenen Sorten (z.B. Mais) erwähnt. Selbstverständlich gelten diese Aussagen auch für in der Zukunft entwickelte bzw. zukünftig auf den Markt kommende Pflanzenarten mit diesen oder zukünftig entwickelten genetischen Eigenschaften („Traits“).

Die aufgeführten Pflanzen können besonders vorteilhaft erfindungsgemäß mit den Verbindungen der allgemeinen Formel (I) bzw. den erfindungsgemäßen Wirkstoffmischungen behandelt werden. Die bei den Wirkstoffen bzw. Mischungen oben angegebenen Vorzugsbereiche gelten auch für die Behandlung dieser Pflanzen.

5 Besonders hervorgehoben sei die Pflanzenbehandlung mit den im vorliegenden Text speziell aufgeführten Verbindungen bzw. Mischungen.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe wirken nicht nur gegen Pflanzen-, Hygiene- und Vorratsschädlinge, sondern auch auf dem veterinärmedizinischen Sektor gegen tierische Parasiten (Ektoparasiten) wie Schildzecken, Lederzecken, Räudemilben, Laufmilben, Fliegen (stechend und leckend), parasitierende Fliegenlarven, Läuse, Haarlinge, Federlinge und Flöhe. Zu diesen Parasiten gehören:

10 15 Aus der Ordnung der Anoplurida z.B. Haematopinus spp., Linognathus spp., Pediculus spp., Phtirus spp., Solenopotes spp..

Aus der Ordnung der Mallophagida und den Unterordnungen Amblycerina sowie Ischnocerina z.B. Trimenopon spp., Menopon spp., Trinoton spp., Bovicola spp., Werneckiella spp., Lepikentron spp., Damalina spp., Trichodectes spp., Felicola spp..

20 Aus der Ordnung Diptera und den Unterordnungen Nematocerina sowie Brachycerina z.B. Aedes spp., Anopheles spp., Culex spp., Simulium spp., Eusimulium spp., Phlebotomus spp., Lutzomyia spp., Culicoides spp., Chrysops spp., Hybomitra spp., Atylotus spp., Tabanus spp., Haematopota spp., Philipomyia spp., Braula spp.,
25 Musca spp., Hydrotaea spp., Stomoxys spp., Haematobia spp., Morellia spp., Fannia spp., Glossina spp., Calliphora spp., Lucilia spp., Chrysomyia spp., Wohlfahrtia spp., Sarcophaga spp., Oestrus spp., Hypoderma spp., Gasterophilus spp., Hippobosca spp., Lipoptena spp., Melophagus spp..

30 Aus der Ordnung der Siphonapterida z.B. Pulex spp., Ctenocephalides spp., Xenopsylla spp., Ceratophyllus spp..

Aus der Ordnung der Heteroptera z.B. Cimex spp., Triatoma spp., Rhodnius spp., Panstrongylus spp..

Aus der Ordnung der Blattaria z.B. Blatta orientalis, Periplaneta americana, Blattella germanica, Supella spp..

5

Aus der Unterklasse der Acaria (Acarida) und den Ordnungen der Meta- sowie Mesostigmata z.B. Argas spp., Ornithodoros spp., Otobius spp., Ixodes spp., Amblyomma spp., Boophilus spp., Dermacentor spp., Haemophysalis spp., Hyalomma spp., Rhipicephalus spp., Dermanyssus spp., Raillietia spp., Pneumonyssus spp., Sternostoma spp., Varroa spp..

10

Aus der Ordnung der Actinedida (Prostigmata) und Acaridida (Astigmata) z.B. Acarapis spp., Cheyletiella spp., Ornithocheyletia spp., Myobia spp., Psorergates spp., Demodex spp., Trombicula spp., Listrophorus spp., Acarus spp., Tyrophagus spp., Caloglyphus spp., Hypodectes spp., Pterolichus spp., Psoroptes spp., Chorioptes spp., Otodectes spp., Sarcoptes spp., Notoedres spp., Knemidocoptes spp., Cytodites spp., Laminosioptes spp..

15

Beispielsweise zeigen sie gute Wirksamkeit gegen die Entwicklungsstadien von Zecken, gegen Fliegen und gegen Flöhe.

20

25

30

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe der Formel (I) eignen sich auch zur Bekämpfung von Arthropoden, die landwirtschaftliche Nutztiere, wie z.B. Rinder, Schafe, Ziegen, Pferde, Schweine, Esel, Kamele, Büffel, Kaninchen, Hühner, Puten, Enten, Gänse, Bienen, sonstige Haustiere wie z.B. Hunde, Katzen, Stubenvögel, Aquarienfische sowie sogenannte Versuchstiere, wie z.B. Hamster, Meerschweinchen, Ratten und Mäuse befallen. Durch die Bekämpfung dieser Arthropoden sollen Todesfälle und Leistungsminderungen (bei Fleisch, Milch, Wolle, Häuten, Eiern, Honig usw.) vermieden werden, so dass durch den Einsatz der erfindungsgemäßen Wirkstoffe eine wirtschaftlichere und einfachere Tierhaltung möglich ist.

Die Anwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe geschieht im Veterinärsektor in bekannter Weise durch enterale Verabreichung in Form von beispielsweise Tabletten, Kapseln, Tränken, Drenchen, Granulaten, Pasten, Boli, des feed-through-Verfahrens, von Zäpfchen, durch parenterale Verabreichung, wie zum Beispiel durch Injektionen (intramuskulär, subcutan, intravenös, intraperitoneal u.a.), Implantate, durch nasale Applikation, durch dermale Anwendung in Form beispielsweise des Tauchens oder Badens (Dippen), Sprühens (Spray), Aufgießens (Pour-on und Spot-on), des Waschens, des Einpuderns sowie mit Hilfe von wirkstoffhaltigen Formkörpern, wie Halsbändern, Ohrmarken, Schwanzmarken, Gliedmaßenbändern, Haltern, Markierungsvorrichtungen usw.

Bei der Anwendung für Vieh, Geflügel, Haustiere etc. kann man die erfindungsgemäßen Wirkstoffe der Formel (I) als Formulierungen (beispielsweise Pulver, Emulsionen, fließfähige Mittel), die die erfindungsgemäßen Wirkstoffe in einer Menge von 1 bis 80 Gew.-% enthalten, direkt oder nach 100 bis 10 000-facher Verdünnung anwenden oder sie als chemisches Bad verwenden.

Außerdem wurde gefunden, dass die erfindungsgemäßen Verbindungen eine hohe insektizide Wirkung gegen Insekten zeigen, die technische Materialien zerstören.

Beispielhaft und vorzugsweise - ohne jedoch zu limitieren - seien die folgenden Insekten genannt:

Käfer wie

Hylotrupes bajulus, Chlorophorus pilosis, Anobium punctatum, Xestobium rufovillosum, Ptilinus pecticornis, Dendrobium pertinex, Ernobius mollis, Priobium carpini, Lyctus brunneus, Lyctus africanus, Lyctus planicollis, Lyctus linearis, Lyctus pubescens, Trogoxylon aequale, Minthes rugicollis, Xyleborus spec. Tryptodendron spec. Apate monachus, Bostrychus capucins, Heterobostrychus brunneus, Sinoxylon spec.

Dinoderus minutus.

Hautflügler wie

Sirex juvencus, Urocerus gigas, Urocerus gigas tagnus, Urocerus augur.

Termiten wie

- 5 Kalotermes flavicollis, Cryptotermes brevis, Heterotermes indicola, Reticulitermes flavipes, Reticulitermes santonensis, Reticulitermes lucifugus, Mastotermes darwiniensis, Zootermopsis nevadensis, Coptotermes formosanus.

Borstenschwänze wie Lepisma saccharina.

10

Unter technischen Materialien sind im vorliegenden Zusammenhang nicht-lebende Materialien zu verstehen, wie vorzugsweise Kunststoffe, Klebstoffe, Leime, Papiere und Kartone, Leder, Holz, Holzverarbeitungsprodukte und Anstrichmittel.

15

Ganz besonders bevorzugt handelt es sich bei dem vor Insektenbefall zu schützenden Material um Holz und Holzverarbeitungsprodukte.

20

Unter Holz und Holzverarbeitungsprodukten, welche durch das erfindungsgemäße Mittel bzw. dieses enthaltende Mischungen geschützt werden kann, ist beispielhaft zu verstehen:

25

Bauholz, Holzbalken, Eisenbahnschwellen, Brückenteile, Bootsstege, Holzfahrzeuge, Kisten, Paletten, Container, Telefonmasten, Holzverkleidungen, Holzfenster und -türen, Sperrholz, Spanplatten, Tischlerarbeiten oder Holzprodukte, die ganz allgemein beim Hausbau oder in der Bautischlerei Verwendung finden.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche, in Form von Konzentraten oder allgemein üblichen Formulierungen wie Pulver, Granulate, Lösungen, Suspensionen, Emulsionen oder Pasten angewendet werden.

30

Die genannten Formulierungen können in an sich bekannter Weise hergestellt werden, z.B. durch Vermischen der erfindungsgemäßen Wirkstoffe mit mindestens

einem Lösungs- bzw. Verdünnungsmittel, Emulgator, Dispergier- und/oder Bindemittel oder Fixiermittels, Wasser-Repellent, gegebenenfalls Sikkative und UV-Stabilisatoren und gegebenenfalls Farbstoffen und Pigmenten sowie weiteren Verarbeitungshilfsmitteln.

5

Die zum Schutz von Holz und Holzwerkstoffen verwendeten insektiziden Mittel oder Konzentrate enthalten den erfindungsgemäßen Wirkstoff in einer Konzentration von 0,0001 bis 95 Gew.-%, insbesondere 0,001 bis 60 Gew.-%.

10

Die Menge der eingesetzten Mittel bzw. Konzentrate ist von der Art und dem Vorkommen der Insekten und von dem Medium abhängig. Die optimale Einsatzmenge kann bei der Anwendung jeweils durch Testreihen ermittelt werden. Im allgemeinen ist es jedoch ausreichend 0,0001 bis 20 Gew.-%, vorzugsweise 0,001 bis 10 Gew.-%, des Wirkstoffs, bezogen auf das zu schützende Material, einzusetzen.

15

Als Lösungs- und/oder Verdünnungsmittel dient ein organisch-chemisches Lösungsmittel oder Lösungsmittelgemisch und/oder ein öliges oder ölartiges schwerflüchtiges organisch-chemisches Lösungsmittel oder Lösungsmittelgemisch und/oder ein polares organisch-chemisches Lösungsmittel oder Lösungsmittelgemisch und/oder Wasser und gegebenenfalls einen Emulgator und/oder Netzmittel.

20

Als organisch-chemische Lösungsmittel werden vorzugsweise ölige oder ölartige Lösungsmittel mit einer Verdunstungszahl über 35 und einem Flammpunkt oberhalb 30°C, vorzugsweise oberhalb 45°C, eingesetzt. Als derartige schwerflüchtige, wasserunlösliche, ölige und ölartige Lösungsmittel werden entsprechende Mineralöle oder deren Aromatenfraktionen oder mineralölhaltige Lösungsmittelgemische, vorzugsweise Testbenzin, Petroleum und/oder Alkylbenzol verwendet.

25

Vorteilhaft gelangen Mineralöle mit einem Siedebereich von 170 bis 220°C, Testbenzin mit einem Siedebereich von 170 bis 220°C, Spindelöl mit einem Siedebereich von 250 bis 350°C, Petroleum bzw. Aromaten vom Siedebereich von 160 bis 280°C, Terpentinöl und dgl. zum Einsatz.

In einer bevorzugten Ausführungsform werden flüssige aliphatische Kohlenwasserstoffe mit einem Siedebereich von 180 bis 210°C oder hochsiedende Gemische von aromatischen und aliphatischen Kohlenwasserstoffen mit einem Siedebereich von 180 bis 220°C und/oder Spindelöl und/oder Monochlornaphthalin, vorzugsweise a-
5 Monochlornaphthalin, verwendet.

- Die organischen schwerflüchtigen ölichen oder ölartigen Lösungsmittel mit einer Verdunstungszahl über 35 und einem Flammpunkt oberhalb 30°C, vorzugsweise oberhalb 45°C, können teilweise durch leicht oder mittelflüchtige organisch-chemische
10 Lösungsmittel ersetzt werden, mit der Maßgabe, dass das Lösungsmittelgemisch ebenfalls eine Verdunstungszahl über 35 und einen Flammpunkt oberhalb 30°C, vorzugsweise oberhalb 45°C, aufweist und dass das Insektizid-Fungizid-Gemisch in diesem Lösungsmittelgemisch löslich oder emulgierbar ist.
15 Nach einer bevorzugten Ausführungsform wird ein Teil des organisch-chemischen Lösungsmittel oder Lösungsmittelgemisches oder ein aliphatisches polares organisch-chemisches Lösungsmittel oder Lösungsmittelgemisch ersetzt. Vorzugsweise gelangen Hydroxyl- und/oder Ester- und/oder Ethergruppen enthaltende aliphatische organisch-chemische Lösungsmittel wie beispielsweise Glycolether, Ester oder dgl.
20 zur Anwendung.

Als organisch-chemische Bindemittel werden im Rahmen der vorliegenden Erfindung die an sich bekannten wasserverdünnbaren und/oder in den eingesetzten organisch-chemischen Lösungsmitteln löslichen oder dispergier- bzw. emulgierbaren
25 Kunstharze und/oder bindende trocknende Öle, insbesondere Bindemittel bestehend aus oder enthaltend ein Acrylatharz, ein Vinylharz, z.B. Polyvinylacetat, Polyesterharz, Polykondensations- oder Polyadditionsharz, Polyurethanharz, Alkydharz bzw. modifiziertes Alkydharz, Phenolharz, Kohlenwasserstoffharz wie Inden-Cumaronharz, Siliconharz, trocknende pflanzliche und/oder trocknende Öle und/oder physikalisch trocknende Bindemittel auf der Basis eines Natur- und/oder Kunstharzes
30 verwendet.

Das als Bindemittel verwendete Kunsthars kann in Form einer Emulsion, Dispersion oder Lösung, eingesetzt werden. Als Bindemittel können auch Bitumen oder bituminöse Substanzen bis zu 10 Gew.-%, verwendet werden. Zusätzlich können an sich bekannte Farbstoffe, Pigmente, wasserabweisende Mittel, Geruchskorrigentien und Inhibitoren bzw. Korrosionsschutzmittel und dgl. eingesetzt werden.

Bevorzugt ist gemäß der Erfindung als organisch-chemische Bindemittel mindestens ein Alkydharz bzw. modifiziertes Alkydharz und/oder ein trocknendes pflanzliches Öl im Mittel oder im Konzentrat enthalten. Bevorzugt werden gemäß der Erfindung Alkydharze mit einem Ölgehalt von mehr als 45 Gew.-%, vorzugsweise 50 bis 68 Gew.-%, verwendet.

Das erwähnte Bindemittel kann ganz oder teilweise durch ein Fixierungsmittel(gemisch) oder ein Weichmacher(gemisch) ersetzt werden. Diese Zusätze sollen einer Verflüchtigung der Wirkstoffe sowie einer Kristallisation bzw. Ausfällen vorbeugen. Vorzugsweise ersetzen sie 0,01 bis 30 % des Bindemittels (bezogen auf 100 % des eingesetzten Bindemittels).

Die Weichmacher stammen aus den chemischen Klassen der Phthalsäureester wie Dibutyl-, Dioctyl- oder Benzylbutylphthalat, Phosphorsäureester wie Tributylphosphat, Adipinsäureester wie Di-(2-ethylhexyl)-adipat, Stearate wie Butylstearat oder Amylstearat, Oleate wie Butyloleat, Glycerinether oder höhermolekulare Glykolether, Glycerinester sowie p-Toluolsulfonsäureester.

Fixierungsmittel basieren chemisch auf Polyvinylalkylethern wie z.B. Polyvinylmethylether oder Ketonen wie Benzophenon, Ethylenbenzophenon.

Als Lösungs- bzw. Verdünnungsmittel kommt insbesondere auch Wasser in Frage, gegebenenfalls in Mischung mit einem oder mehreren der oben genannten organisch-chemischen Lösungs- bzw. Verdünnungsmittel, Emulgatoren und Dispergatoren.

Ein besonders effektiver Holzschutz wird durch großtechnische Imprägnierverfahren, z.B. Vakuum, Doppelvakuum oder Druckverfahren, erzielt.

Die anwendungsfertigen Mittel können gegebenenfalls noch weitere Insektizide und
5 gegebenenfalls noch ein oder mehrere Fungizide enthalten.

Als zusätzliche Zumischpartner kommen vorzugsweise die in der WO 94/29 268 genannten Insektizide und Fungizide in Frage. Die in diesem Dokument genannten Verbindungen sind ausdrücklicher Bestandteil der vorliegenden Anmeldung.

10 Als ganz besonders bevorzugte Zumischpartner können Insektizide, wie Chlorpyriphos, Phoxim, Silafluofin, Alphamethrin, Cyfluthrin, Cypermethrin, Delta-methrin, Permethrin, Imidacloprid, NI-25, Flufenoxuron, Hexaflumuron, Trans-fluthrin, Thiacloprid, Methoxyphenoxid und Triflumuron, sowie Fungizide wie Epoxyconazole, Hexaconazole, Azaconazole, Propiconazole, Tebuconazole, Cypro-conazole, Metconazole, Imazalil, Dichlorfluanid, Tolyfluanid, 3-Iod-2-propinyl-butylcarbamid, N-Octyl-isothiazolin-3-on und 4,5-Dichlor-N-octylisothiazolin-3-on, sein.
...

20 Zugleich können die erfindungsgemäßen Verbindungen zum Schutz vor Bewuchs von Gegenständen, insbesondere von Schiffskörpern, Sieben, Netzen, Bauwerken, Kaianlagen und Signalanlagen, welche mit See- oder Brackwasser in Verbindung kommen, eingesetzt werden.

25 Bewuchs durch sessile Oligochaeten, wie Kalkröhrenwürmer sowie durch Muscheln und Arten der Gruppe Ledamorpha (Entenmuscheln), wie verschiedene Lepas- und Scalpellum-Arten, oder durch Arten der Gruppe Balanomorpha (Seepocken), wie Balanus- oder Pollicipes-Species, erhöht den Reibungswiderstand von Schiffen und führt in der Folge durch erhöhten Energieverbrauch und darüber hinaus durch häufige
30 Trockendockaufenthalte zu einer deutlichen Steigerung der Betriebskosten.

Neben dem Bewuchs durch Algen, beispielsweise *Ectocarpus* sp. und *Ceramium* sp., kommt insbesondere dem Bewuchs durch sessile Entomostraken-Gruppen, welche unter dem Namen Cirripedia (Rankenflusskrebse) zusammengefasst werden, besondere Bedeutung zu.

5

Es wurde nun überraschenderweise gefunden, dass die erfindungsgemäßen Verbindungen allein oder in Kombination mit anderen Wirkstoffen, eine hervorragende Antifouling (Antibewuchs)-Wirkung aufweisen.

10

Durch Einsatz von erfindungsgemäßen Verbindungen allein oder in Kombination mit anderen Wirkstoffen, kann auf den Einsatz von Schwermetallen wie z.B. in Bis(trialkylzinn)-sulfiden, Tri-*n*-butylzinnlaurat, Tri-*n*-butylzinnchlorid, Kupfer(I)-oxid, Triethylzinnchlorid, Tri-*n*-butyl(2-phenyl-4-chlorphenoxy)-zinn, Tributylzinnoxid, Molybdändisulfid, Antimonoxid, polymerem Butyltitanat, Phenyl-(bispyridin)-wismutchlorid, Tri-*n*-butylzinnfluorid, Manganethylenbisthiocarbamat, Zinkdimethyldithiocarbamat, Zinkethylenbisthiocarbamat, Zink- und Kupfersalze von 2-Pyridinthiol-1-oxid, Bisdimethyldithiocarbamoylzinkethylenbisthiocarbamat, Zinkoxid, Kupfer(I)-ethylen-bisdithiocarbamat, Kupferthiocyanat, Kupfernaphthenat und Tributylzinnhalogeniden verzichtet werden oder die Konzentration dieser Verbindungen entscheidend reduziert werden.

15

Die anwendungsfertigen Antifoulingfarben können gegebenenfalls noch andere Wirkstoffe, vorzugsweise Algizide, Fungizide, Herbizide, Molluskizide bzw. andere Antifouling-Wirkstoffe enthalten.

20

Als Kombinationspartner für die erfindungsgemäßen Antifouling-Mittel eignen sich vorzugsweise:

Algizide wie

25

2-*tert*.-Butylamino-4-cyclopropylamino-6-methylthio-1,3,5-triazin, Dichlorophen, Diuron, Endothal, Fentinacetat, Isoproturon, Methabenzthiazuron, Oxyfluorfen, Quinoclamine und Terbutryn;

Fungizide wie

Benzo[*b*]thiophencarbonsäurecyclohexylamid-S,S-dioxid, Dichlofluanid, Fluorfolpet, 3-Iod-2-propinyl-butylcarbamat, Tolyfluanid und Azole wie

Azaconazole, Cyproconazole, Epoxyconazole, Hexaconazole, Metconazole, Propiconazole und Tebuconazole;

5

Molluskizide wie

Fentinacetat, Metaldehyd, Methiocarb, Niclosamid, Thiodicarb und Trimethacarb; oder herkömmliche Antifouling-Wirkstoffe wie

10 4,5-Dichlor-2-octyl-4-isothiazolin-3-on, Diiodmethylparatrylsulfon, 2-(N,N-Dimethylthiocarbamoylthio)-5-nitrothiazyl, Kalium-, Kupfer-, Natrium- und Zinksalze von 2-Pyridinthiol-1-oxid, Pyridin-triphenylboran, Tetrabutyldistannoxan, 2,3,5,6-Tetrachlor-4-(methylsulfonyl)-pyridin, 2,4,5,6-Tetrachloroisophthalonitril, Tetramethylthiuramdisulfid und 2,4,6-Trichlorphenylmaleinimid.

15 Die verwendeten Antifouling-Mittel enthalten die erfindungsgemäßen Wirkstoff der erfindungsgemäßen Verbindungen in einer Konzentration von 0,001 bis 50 Gew.-%, insbesondere von 0,01 bis 20 Gew.-%.

20 Die erfindungsgemäßen Antifouling-Mittel enthalten des weiteren die üblichen Bestandteile wie z.B. in Ungerer, *Chem. Ind.* 1985, 37, 730-732 und Williams, Anti-fouling Marine Coatings, Noyes, Park Ridge, 1973 beschrieben.

Antifouling-Anstrichmittel enthalten neben den algiziden, fungiziden, molluskiziden und erfindungsgemäßen insektiziden Wirkstoffen insbesondere Bindemittel.

25

Beispiele für anerkannte Bindemittel sind Polyvinylchlorid in einem Lösungsmittelsystem, chlorierter Kautschuk in einem Lösungsmittelsystem, Acrylharze in einem Lösungsmittelsystem insbesondere in einem wässrigen System, Vinylchlorid/Vinylacetat-Copolymersysteme in Form wässriger Dispersionen oder in Form von organischen Lösungsmittelsystemen, Butadien/Styrol/Acrylnitril-Kautschuke, trocknende Öle, wie Leinsamenöl, Harzester oder modifizierte Hartharze in Kombination

30

mit Teer oder Bitumina, Asphalt sowie Epoxy-Verbindungen, geringe Mengen Chlorkautschuk, chloriertes Polypropylen und Vinylharze.

Gegebenenfalls enthalten Anstrichmittel auch anorganische Pigmente, organische 5 Pigmente oder Farbstoffe, welche vorzugsweise in Seewasser unlöslich sind. Ferner können Anstrichmittel Materialien, wie Kolophonium enthalten, um eine gesteuerte Freisetzung der Wirkstoffe zu ermöglichen. Die Anstriche können ferner Weichmacher, die rheologischen Eigenschaften beeinflussende Modifizierungsmittel sowie andere herkömmliche Bestandteile enthalten. Auch in Self-Polishing-Antifouling- 10 Systemen können die erfindungsgemäßen Verbindungen oder die oben genannten Mischungen eingearbeitet werden.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich auch zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen, insbesondere von Insekten, Spinnentieren und Milben, die in geschlos- 15 senen Räumen, wie beispielsweise Wohnungen, Fabrikhallen, Büros, Fahrzeugkabinen u.ä. vorkommen. Sie können zur Bekämpfung dieser Schädlinge allein oder in Kombination mit anderen Wirk- und Hilfsstoffen in Haushaltsinsektizid-Produkten verwendet werden. Sie sind gegen sensible und resistente Arten sowie gegen alle Entwicklungsstadien wirksam. Zu diesen Schädlingen gehören:

20

Aus der Ordnung der Scorpionidea z.B. *Buthus occitanus*.

Aus der Ordnung der Acarina z.B. *Argas persicus*, *Argas reflexus*, *Bryobia* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Glyciphagus domesticus*, *Ornithodoros moubat*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Trombicula alfreddugesi*, *Neutrombicula autumnalis*, *Dermato-* 25 *phagoides pteronissimus*, *Dermatophagoides farinae*.

Aus der Ordnung der Araneae z.B. *Aviculariidae*, *Araneidae*.

Aus der Ordnung der Opiliones z.B. *Pseudoscorpiones chelifer*, *Pseudoscorpiones cheiridium*, *Opiliones phalangium*.

Aus der Ordnung der Isopoda z.B. *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*.

30

Aus der Ordnung der Diplopoda z.B. *Blaniulus guttulatus*, *Polydesmus* spp..

Aus der Ordnung der Chilopoda z.B. *Geophilus* spp..

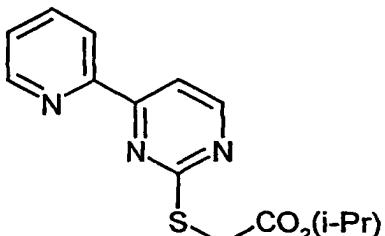
- Aus der Ordnung der Zygentoma z.B. *Ctenolepisma* spp., *Lepisma saccharina*, *Lepismodes inquilinus*.
- Aus der Ordnung der Blattaria z.B. *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Blattella asahinai*, *Leucophaea maderae*, *Panchlora* spp., *Parcoblatta* spp., *Periplaneta australasiae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Supella longipalpa*.
- 5 Aus der Ordnung der Saltatoria z.B. *Acheta domesticus*.
- Aus der Ordnung der Dermaptera z.B. *Forficula auricularia*.
- Aus der Ordnung der Isoptera z.B. *Kalotermes* spp., *Reticulitermes* spp.
- 10 Aus der Ordnung der Psocoptera z.B. *Lepinatus* spp., *Liposcelis* spp.
- Aus der Ordnung der Coleoptera z.B. *Anthrenus* spp., *Attagenus* spp., *Dermestes* spp., *Latheticus oryzae*, *Necrobia* spp., *Ptinus* spp., *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus granarius*, *Sitophilus oryzae*, *Sitophilus zeamais*, *Stegobium paniceum*.
- Aus der Ordnung der Diptera z.B. *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes taeniorhynchus*, *Anopheles* spp., *Calliphora erythrocephala*, *Chrysozona pluvialis*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex pipiens*, *Culex tarsalis*, *Drosophila* spp., *Fannia canicularis*, *Musca domestica*, *Phlebotomus* spp., *Sarcophaga carnaria*, *Simulium* spp., *Stomoxys calcitrans*, *Tipula paludosa*.
- 15 Aus der Ordnung der Lepidoptera z.B. *Achroia grisella*, *Galleria mellonella*, *Plodia interpunctella*, *Tinea cloacella*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*.
- Aus der Ordnung der Siphonaptera z.B. *Ctenocephalides canis*, *Ctenocephalides felis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, *Xenopsylla cheopis*.
- Aus der Ordnung der Hymenoptera z.B. *Camponotus herculeanus*, *Lasius fuliginosus*, *Lasius niger*, *Lasius umbratus*, *Monomorium pharaonis*, *Paravespula* spp.,
- 25 *Tetramorium caespitum*.
- Aus der Ordnung der Anoplura z.B. *Pediculus humanus capititis*, *Pediculus humanus corporis*, *Phthirus pubis*.
- Aus der Ordnung der Heteroptera z.B. *Cimex hemipterus*, *Cimex lectularius*, *Rhodnius prolixus*, *Triatoma infestans*.
- 30 Die Anwendung im Bereich der Haushaltsinsektizide erfolgt allein oder in Kombination mit anderen geeigneten Wirkstoffen wie Phosphorsäureestern, Carbamataten,

Pyrethroiden, Wachstumsregulatoren oder Wirkstoffen aus anderen bekannten Insektizidklassen.

Die Anwendung erfolgt in Aerosolen, drucklosen Sprühmitteln, z.B. Pump- und Zerstäubersprays, Nebelautomaten, Foggern, Schäumen, Gelen, Verdampferprodukten mit Verdampferplättchen aus Cellulose oder Kunststoff, Flüssigverdampfern, Gel- und Membranverdampfern, propellergetriebenen Verdampfern, energielosen bzw. passiven Verdampfungssystemen, Mottenpapieren, Mottensäckchen und Motten-gelen, als Granulate oder Stäube, in Streuködern oder Köderstationen.

10

Die Herstellung und die Verwendung der erfindungsgemäßen Stoffe geht aus den folgenden Beispielen hervor.

HerstellungsbeispieleBeispiel 1

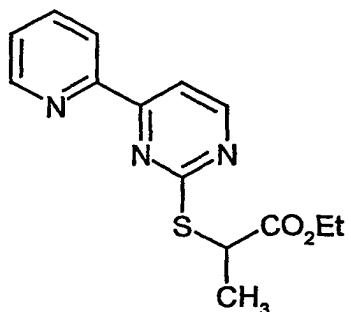
0,57 g (3 mmol) 4-(2-Pyridinyl)-2-pyrimidinethiol und 1,66 g (12 mmol) Kaliumcarbonat werden in 30 ml Acetonitril vorgelegt. Nach Zugabe von 0,41 g (3 mmol) 2-Chloressigsäureisopropylester wird für 16 h bei 60°C gerührt. Zur Aufarbeitung

10 wird das Reaktionsgemisch unter verminderterem Druck eingeengt, zwischen Wasser und Methylenchlorid verteilt, die organische Phase getrocknet und unter verminder-

tem Druck eingeengt.

Man erhält 0,72 g (79 % d. Th.) an Isopropyl-{[4-(2-pyridinyl)-2-pyrimidinyl]thio}-acetat als Oel.

15 HPLC: Log P (pH 2,3) = 2,56.

Beispiel 2

20

35,6 mg (0,188 mmol) 4-(2-Pyridinyl)-2-pyrimidinethiol und 104 mg (0,752 mmol) Kaliumcarbonat werden in 5 ml Tetrahydrofuran vorgelegt. Nach Zugabe von

34,0 mg (0,188 mmol) 2-Brompropionsäureethylester wird für 16 h bei 60°C gerührt.

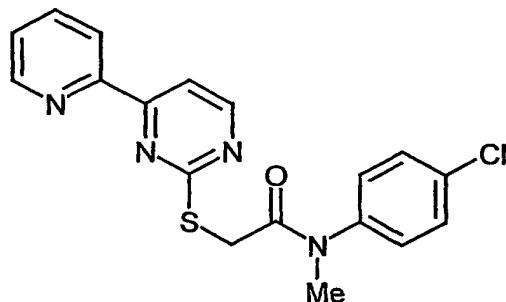
Zur Aufarbeitung werden 0,5 ml Wasser und 2 ml Essigsäureethylester zugesetzt, 30 min gerührt und das Reaktionsgemisch über eine Extrelut-Kieselgelkartusche gegeben und anschließend unter verminderterem Druck eingeengt.

- 5 Man erhält 41 mg (70 % d. Th.) an Ethyl-2-{{[4-(2-pyridinyl)-2-pyrimidinyl]thio}propanoat.

HPLC: Log P (pH 2,3) = 2,74.

Beispiel 3

10

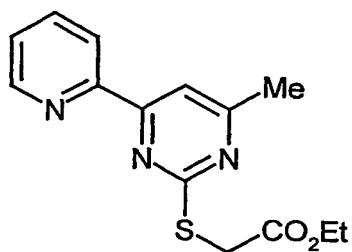


- 0,57 g (3 mmol) 4-(2-Pyridinyl)-2-pyrimidinthiol und 1,66 g (12 mmol) Kaliumcarbonat werden in 30 ml Acetonitril vorgelegt. Nach Zugabe von 0,65 g (3 mmol) 15 N-(4-Chlorphenyl)-N-Methyl-2-chloracetamid wird für 16 h bei 60°C gerührt. Zur Aufarbeitung wird unter verminderterem Druck eingeengt, zwischen Wasser und Methylenchlorid verteilt, die organische Phase getrocknet und unter verminderterem Druck eingeengt.

- Man erhält 1,09 g (81 % d. Th.) an N-(4-Chlorphenyl)-N-methyl-2-{{[4-(2-pyridinyl)-2-pyrimidinyl]thio}acetamid.

HPLC: Log P (pH 2,3) = 2,73.

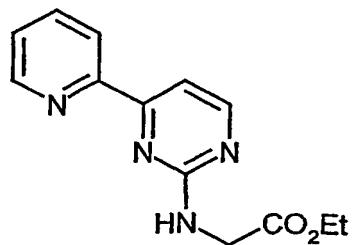
Fp. 142°C.

Beispiel 4

- 5 0,30 g (1,04 mmol) Ethyl-[{(4-brom-6-methyl-2-pyrimidinyl)thio]acetat, 0,38 g (1,04 mmol) 2-(Tributylstannyly)pyridin und 0,06 g (0,05 mmol) Tetrakis(triphenylphosphin)palladium werden unter Argon in 10 ml Xylool vorgelegt und 16 h refluxiert. Zur Aufarbeitung wird unter verminderterem Druck eingeengt und das Rohprodukt an Kieselgel (Laufmittel: Dichlormethan) chromatographiert.
- 10 Man erhält 0,215 g (70 % d. Th.) an Ethyl-{[4-methyl-6-(2-pyridinyl)-2-pyrimidinyl]thio}acetat.
- HPLC: Log P (pH 2,3) = 2,45.

Beispiel 5

15



- 0,71 g (3 mmol) 2-(Methylsulfonyl)-4-(2-pyridinyl)pyrimidin und 0,33 g (3 mmol) Triethylamin werden in 30 ml Ethanol vorgelegt, mit 0,46 g (3,3 mmol) Glycinethyl-ester-Hydrochlorid versetzt und für 16 h refluxiert. Zur Aufarbeitung wird das Reaktionsgemisch unter verminderterem Druck eingeengt, in Dichlormethan aufgenommen, mit Natriumhydrogencarbonatlösung und Zitronensäurelösung gewaschen, getrocknet

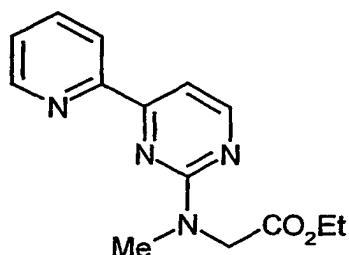
und unter verminderterem Druck eingeengt. Das Rohprodukt wird an Kieselgel (Laufmittel: Dichlormethan/Aceton 95:5) chromatographiert.

Man erhält 0,12 g (13 % d. Th.) an Ethyl-N-[4-(2-pyridinyl)-2-pyrimidinyl]glycinat.

HPLC Log P_w(pH 2,3) = 1,14.

5 Fp. 85°C.

Beispiel 6

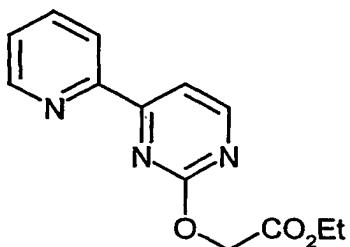


10

0,41 g (1,74 mmol) 2-(Methylsulfonyl)-4-(2-pyridinyl)pyrimidin und 0,48 g (3,49 mmol) Kaliumcarbonat werden in 20 ml DMF vorgelegt, mit 0,29 g (1,92 mmol) N-Methyl-glycinethylester-Hydrochlorid versetzt und für 16 h bei 80°C gerührt. Zur Aufarbeitung wird unter verminderterem Druck eingeengt, in Dichlormethan aufgenommen, mit Natriumhydrogencarbonatlösung und Zitronensäurelösung gewaschen, getrocknet und unter verminderterem Druck eingeengt. Das Rohprodukt wird an Kieselgel (Laufmittel: Dichlormethan/Aceton 95:5) chromatographiert.

15 Man erhält 0,14 g (30 % d. Th.) an Ethyl-N-methyl-N-[4-(2-pyridinyl)-2-pyrimidinyl]glycinat als Oel.

20 HPLC: Log P_w(pH 2,3) = 1,66.

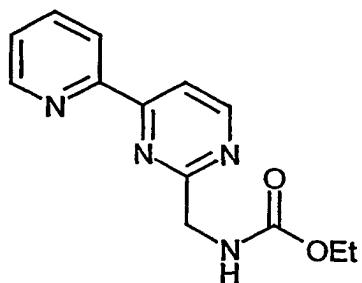
Beispiel 7

5 0,71 g (3 mmol) 2-(Methylsulfonyl)-4-(2-pyridinyl)pyrimidin werden in 3 ml Glykolsäureethylester vorgelegt. Anschließend werden bei einer Temperatur von kleiner 35°C portionsweise 0,18 g (4,5 mmol) Natriumhydrid (60 %ig) zugesetzt. Man röhrt 30 min bei Raumtemperatur nach, versetzt dann mit Wasser und extrahiert mit Dichlormethan. Das Rohprodukt wird an Kieselgel (Laufmittel: Dichlormethan/Aceton 10 95:5) chromatographiert.

Man erhält 0,39 g (46 % d. Th.) an Ethyl-{[4-(2-pyridinyl)-2-pyrimidinyl]oxy}acetat.

HPLC: Log P (pH 2,3) = 1,73

Fp. 48-53°C

15 Beispiel 8

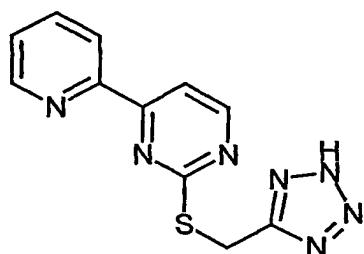
20 0,88 g (5 mmol) 3-(Dimethyl-amino)-1-(2-pyridinyl)-2-propen-1-on, 0,91 g (5 mmol) Methyl-2-amino-2-iminoethylcarbamat-Hydrochlorid und 0,68 g (10 mmol) Natriummethyllat werden in 20 ml Ethanol vorgelegt und für 16 h refluxiert. Zur Aufarbeitung wird unter verminderter Druck eingeengt, in Dichlormethan auf-

genommen, mit Zitronensäurelösung gewaschen, getrocknet und unter verminderter Druck eingeengt.

Man erhält 0,35 g (25 % d. Th.) an Ethyl-[4-(2-pyridinyl)-2-pyrimidinyl]methylcarbamat.

- 5 HPLC: Log P (pH 2,3) = 1,14.

Beispiel 9



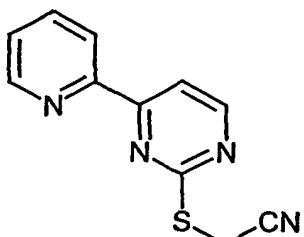
10

0,6g (2,6 mmol) 4-(2-Pyridinyl)-pyrimidin-2-thioacetonitril und 0,54g (2,6 mmol) Trimethylzinnazid werden in 30 ml Toluol für 16 Stunden unter Rückfluss erhitzt. Zur Aufarbeitung wird eingeengt, in Natronlauge (10%ig in Wasser) gelöst und zur Entfernung unlöslicher Bestandteile filtriert. Das Filtrat wird mit Salzsäure (10%ig in

15 Wasser) auf pH 4 eingestellt und mit Essigsäureethylester extrahiert. Die organische Phase wird getrocknet und unter verminderter Druck eingeengt. Zur Entfernung letzter Spuren von Zinnderivaten wird das Rohprodukt in Dichlormethan gelöst und 5 Stunden mit einer gesättigten Kaliumfluoridlösung verrührt. Die organische Phase wird erneut getrocknet und unter verminderter Druck eingeengt.

20 Man erhält 0,4g (57% d. Th.) an 4-(2-Pyridinyl)-pyrimidin-2-thiomethyl-tetrazol.

Fp. 162°C.

Herstellung von AusgangsstoffenNitrile der Formel (XIV)

5

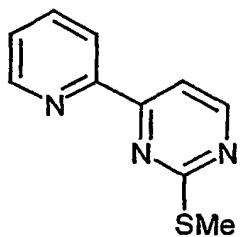
0,95g (5 mmol) 4-(2-Pyridinyl)-2-pyrimidinthiol, 0,75g (10 mmol) Chloracetonitril und 2,46g (30 mmol) Natriumacetat werden in 30 ml Ethanol 6 Stunden unter Rückfluss gekocht und anschließend eingeengt. Nach Verteilung zwischen Dichlormethan und Wasser wird die organische Phase abgetrennt, getrocknet und eingeengt.

10

Man erhält 0,95g (75% d. Th.) an 4-(2-Pyridinyl)-pyrimidin-2-thioacetonitril.

HPLC: Log P (pH 2,3) = 1,68.

15

Methylthio-Derivate der Formel (XVI)

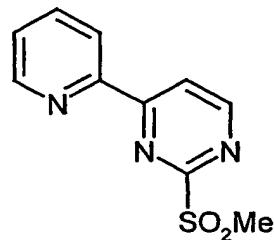
20

4,73 g (25 mmol) 4-(2-Pyridinyl)-2-pyrimidinthiol und 5,18 g (37,5 mmol) Kaliumcarbonat werden in 50 ml Acetonitril vorgelegt. Man tropft 3,55 g (25 mmol) Iodmethan zu und röhrt für 16 h bei 40°C nach. Zur Aufarbeitung wird unter verminderter Druck eingeengt, zwischen Wasser und Methylenchlorid verteilt, die organische Phase getrocknet und unter verminderter Druck eingeengt.

Man erhält 4,45 g (81 % d. Th.) 2-(Methylthio)-4-(2-pyridinyl)pyrimidin.

HPLC: Log P (pH, 2,3) = 1,93.

5 Methylsulfonylpyrimidine der Formel (VII)



4,07 g (20 mmol) 2-(Methylthio)-4-(2-pyridinyl)pyrimidin werden in 100 ml Di-chlormethan gelöst. Man setzt unter Eiskühlung portionsweise 10,85 g (44 mmol) 10 m-Chlorperbenzoësäure (70 %ig) zu und röhrt für 16 h bei Raumtemperatur. Die organische Phase wird nacheinander mit gesättigter Natriumhydrogencarbonatlösung und Natriumhydrogensulfatlösung gewaschen, getrocknet und unter verminderter Druck eingeengt.

15 Man erhält 3,6 g (53 % d. Th.) an 2-(Methylsulfonyl)-4-(2-pyridinyl)pyrimidin.

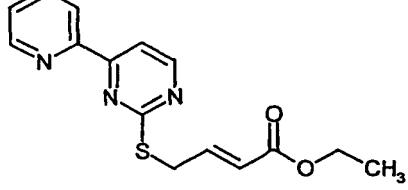
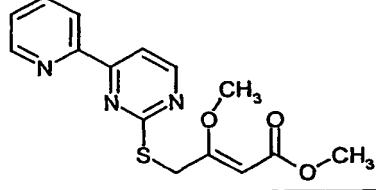
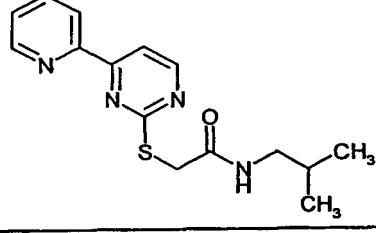
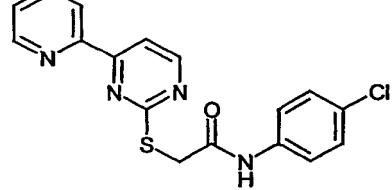
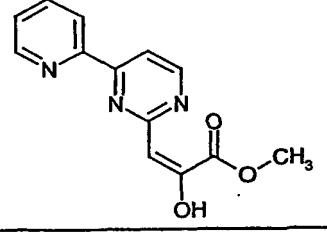
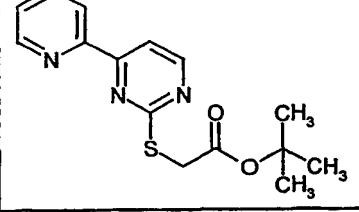
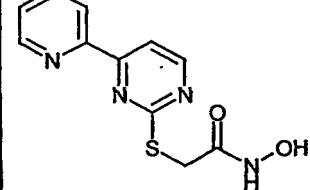
HPLC: Log P (pH 2,3) = 0,99.

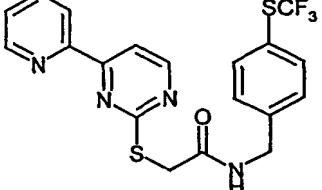
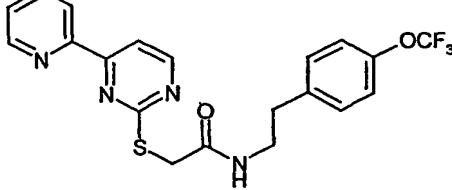
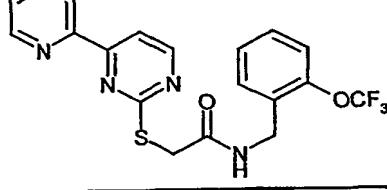
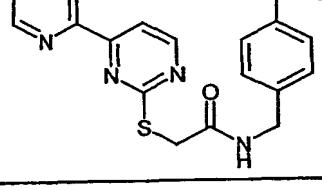
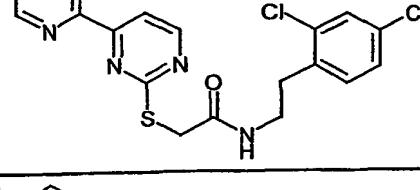
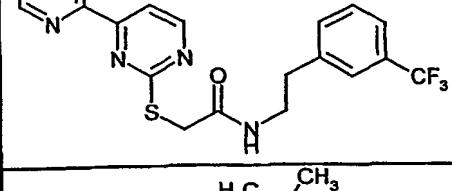
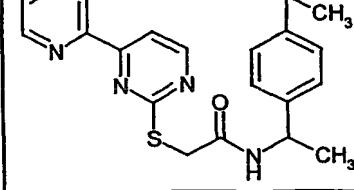
Die in der folgenden Tabelle aufgeführten Verbindungen können entsprechend einem der oben beschriebenen erfindungsgemäßen Verfahren hergestellt werden.

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
10		1.81	95
11		1.14	181
12		1.37	125
13		2.17	78-80
14		1.76	
15		2.88	
16		2.76	

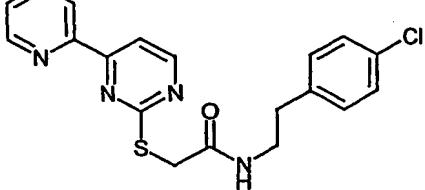
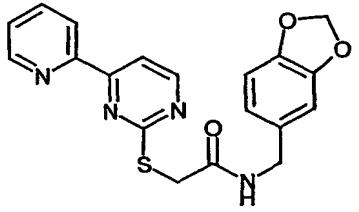
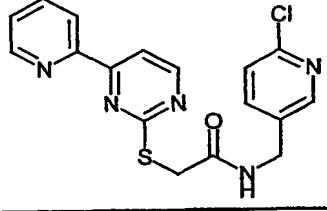
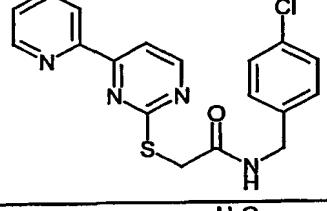
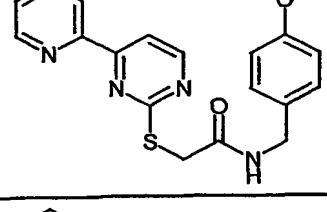
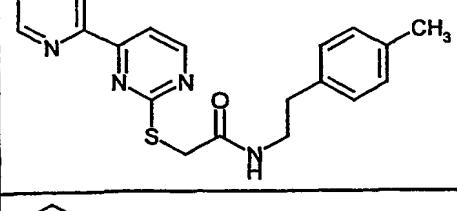
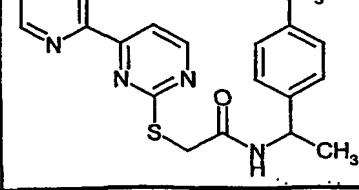
Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
17		2.34	108
18		2.40	68
19		2.99	88
20		1.97	
21		3.53	
22		2.58	
23		2.34	95

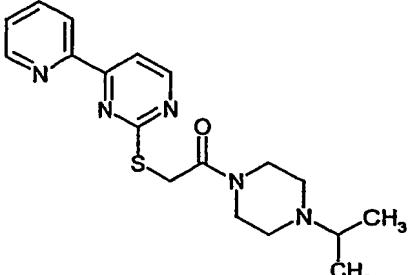
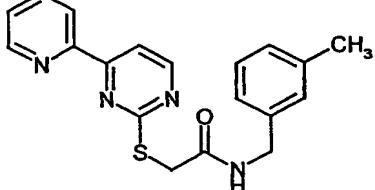
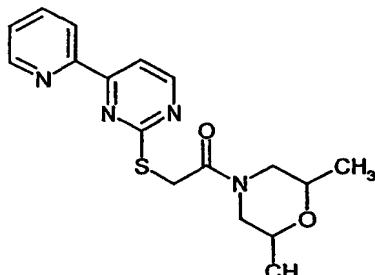
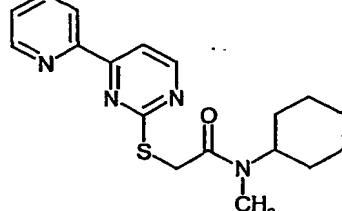
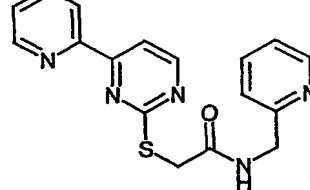
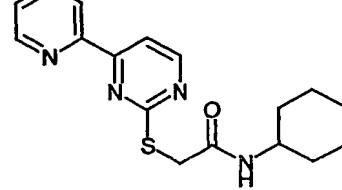
Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
24		2.16	
25		2.68	
26		3.50	118
27		3.84	
28		1.80	120
29		0.69	172

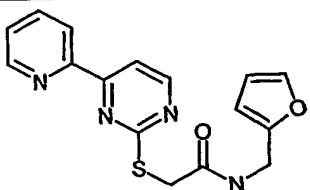
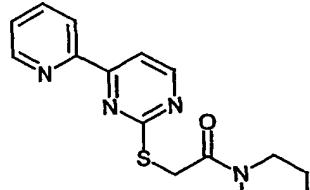
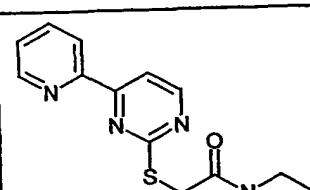
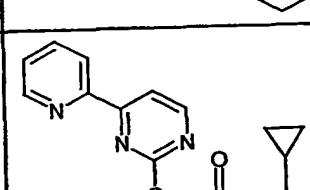
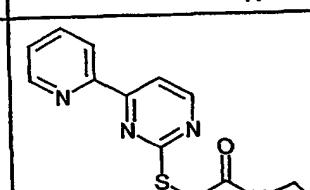
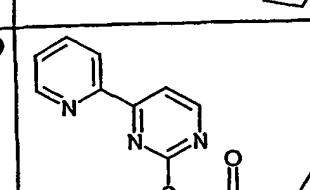
Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
30		2.92	
31		2.70	
32		1.81	
33		2.58	
34		1.89	183
35		2.96	86
36		0.55	157

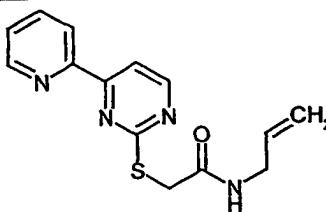
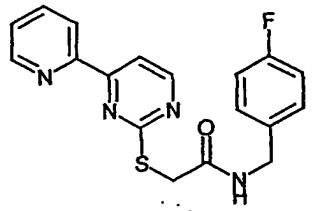
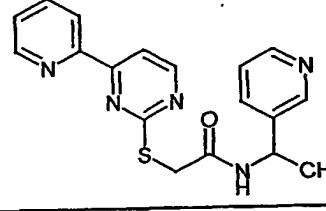
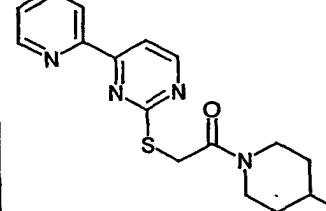
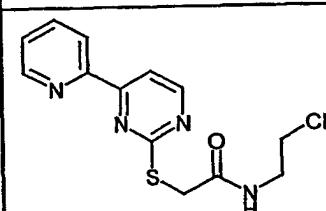
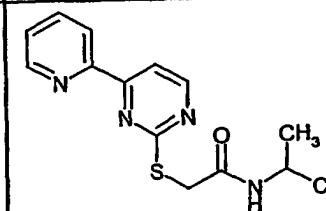
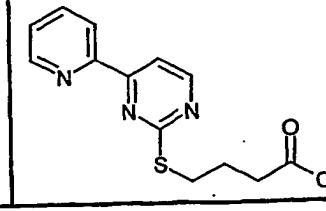
Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
37		2.93	
38		2.96	
39		2.72	
40		2.76	
41		2.83	
42		2.82	
43		3.40	

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
44		2.64	
45		2.69	
46		2.62	
47		2.64	
48		2.42	
49		2.01	
50		2.58	

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
51		2.58	
52		1.94	
53		1.71	
54		2.38	
55		2.00	
56		2.56	
57		2.48	

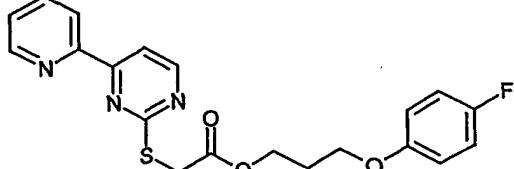
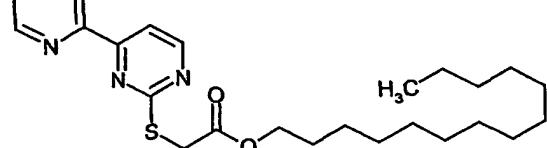
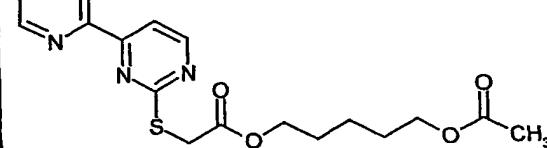
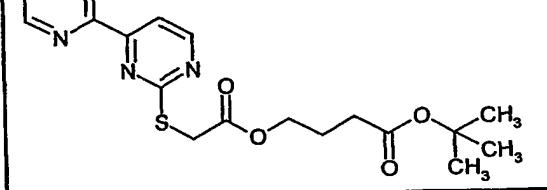
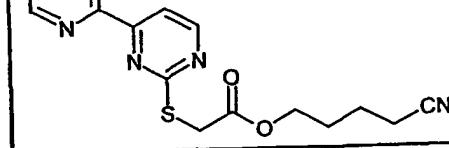
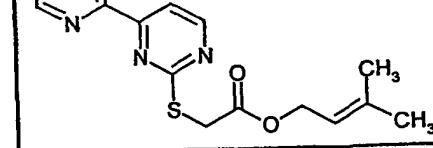
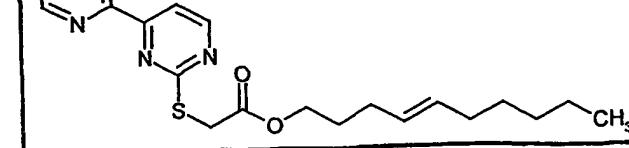
Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
58		0.95	
59		2.29	
60		1.94	
61		2.67	
62		1.14	
63		2.31	

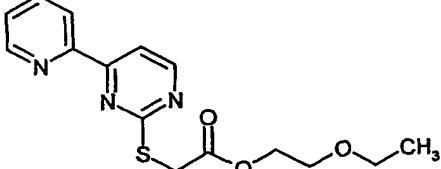
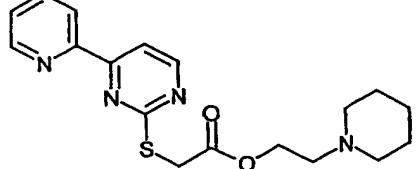
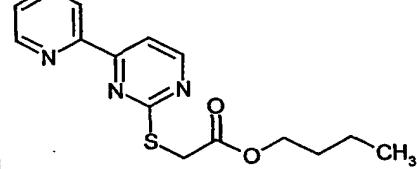
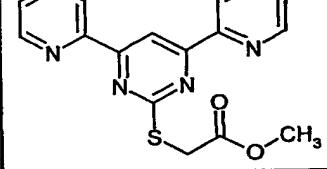
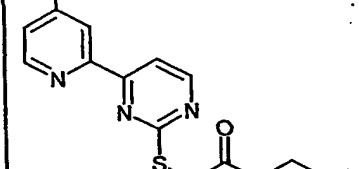
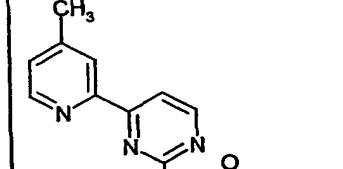
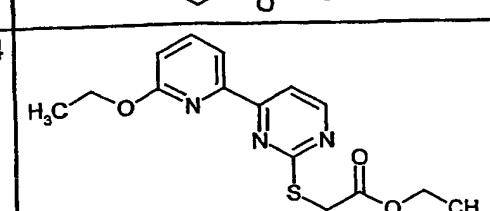
Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
64		1.82	
65		1.55	
66		2.09	
67		1.83	
68		1.75	
69		1.56	

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
70		1.65	
71			
72			
73			
74			
75			
76		2.35	

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
77		3.46	136
78		2.13	87-95
79		2.68	
80		3.96	
81			
82			
83		3.37	

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
84		2.72	
85		6.15	
86		7.22	
87			
88		3.86	
89		3.56	
90			

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
91		3.59	
92			
93		2.82	
94		3.48	
95		2.29	
96		3.18	
97			

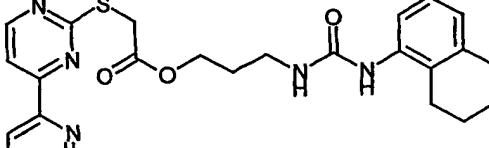
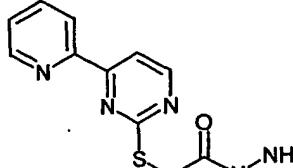
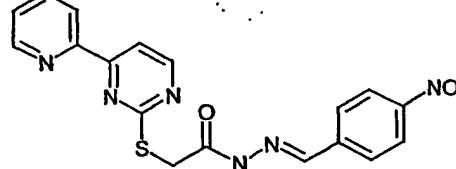
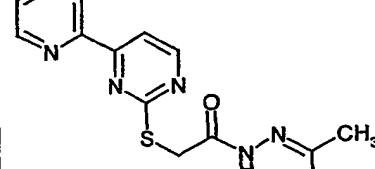
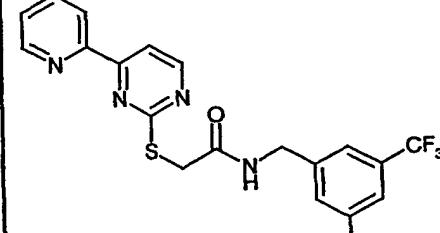
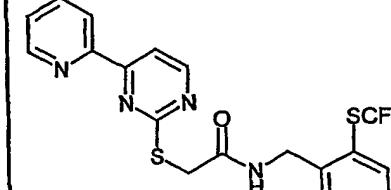
Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
98		2.34	
99		1.04	
100		3.07	
101		2.81	117
102		2.20	60
103		1.80	105
104		3.67	

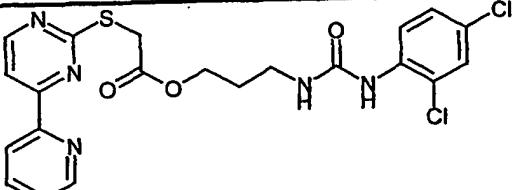
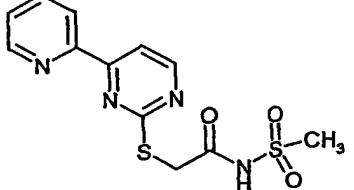
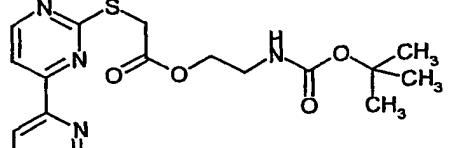
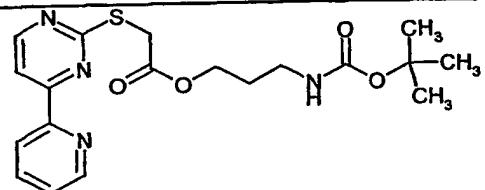
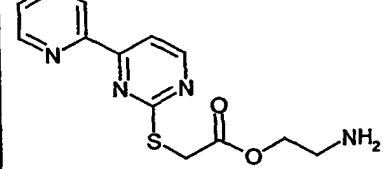
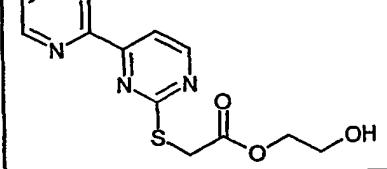
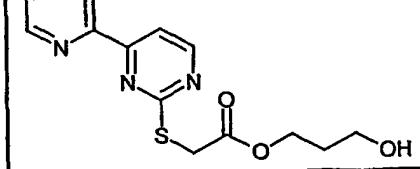
Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
105		2.46	
106		3.01	
107		3.50	
108		0.89	
109		3.57	
110		1.13	
111		3.19	

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
112		3.11	
113		2.55	
114		3.34	
115		3.30	
116		2.25	
117		2.69	
118		3.24	

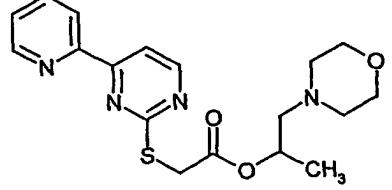
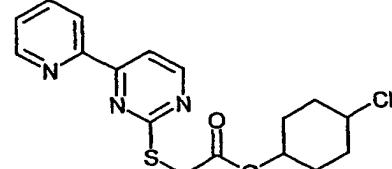
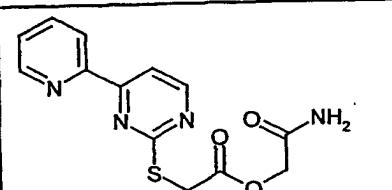
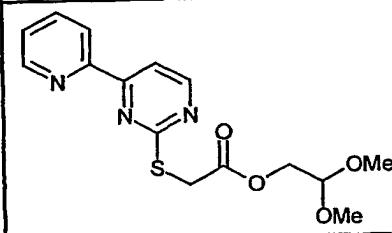
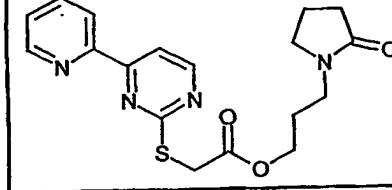
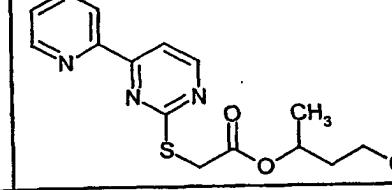
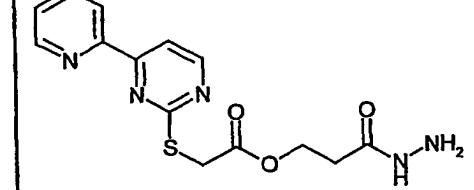
Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
119		3.37	
120		3.59	
121		3.06	
122		2.26	
123		2.78	
124		2.31	
125		3.31	

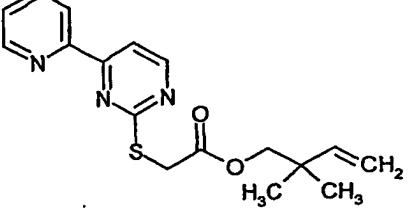
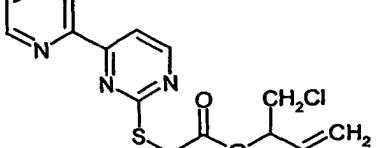
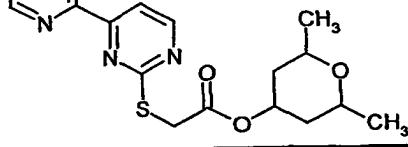
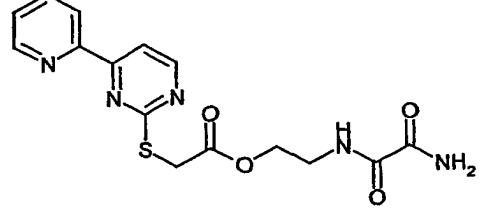
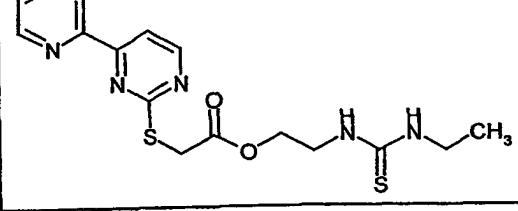
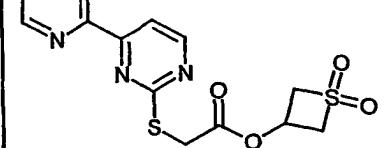
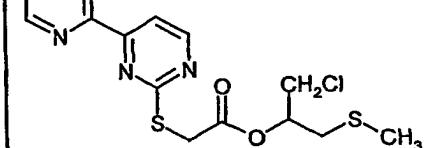
Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
126		2.29	
127		1.76	
128		2.50	
129		2.51	
130		3.51	
131		3.45	
132			

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
133		3.06	
134		0.43	184
135		2.23	220
136		0.44	195
137		3.22	
138		2.92	

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
139		3.20	
140		1.13	
141		2.63	
142		2.79	
143			
144			
145			

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
154		3.60	
155			
156			
157			
158		1.98	
159		4.00	
160		1.59	

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
161		1.16	
162			
163		1.11	
164		2.05	
165		1.64	
166			
167			

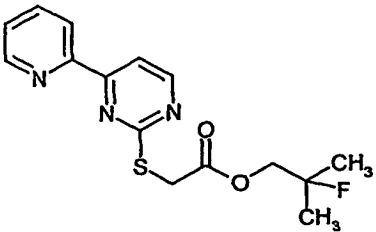
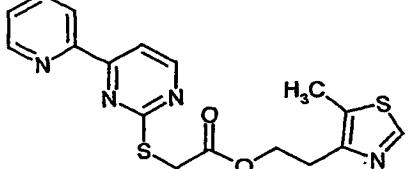
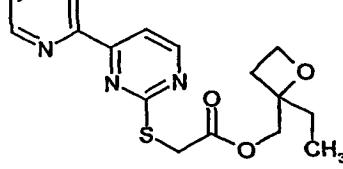
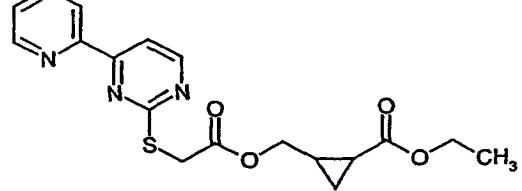
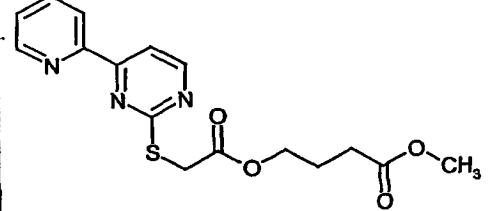
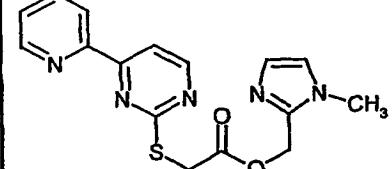
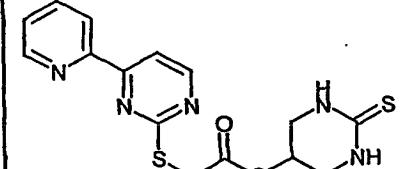
Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
168		3.48	
169			
170			
171			
172		1.79	
173		1.67	
174			

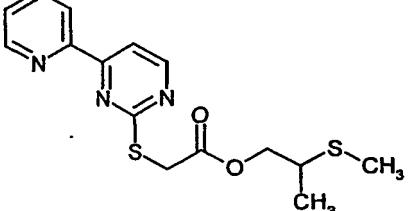
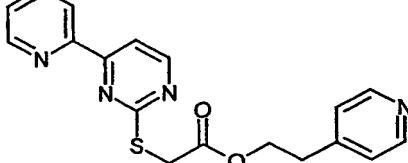
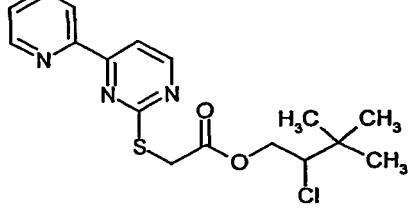
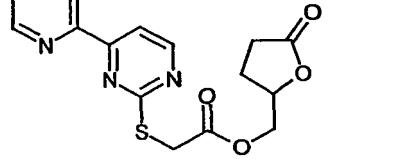
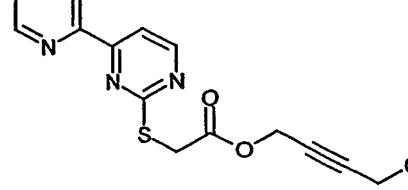
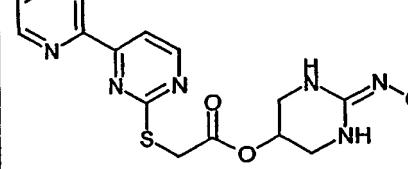
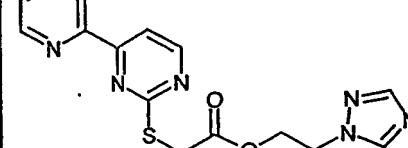
Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
175		1.64	
176		1.93	
177		1.41	
178		2.20	
179		2.29	
180			
181			

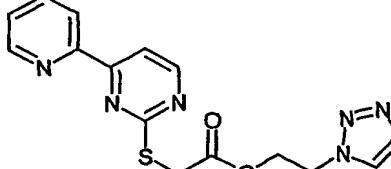
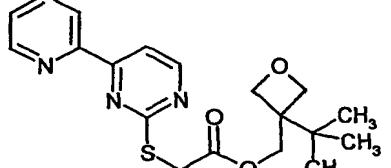
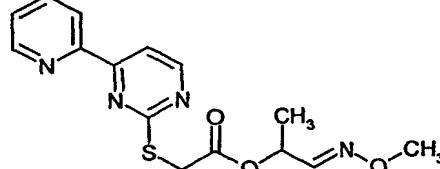
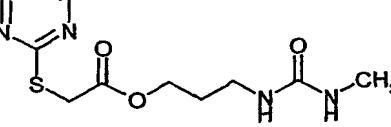
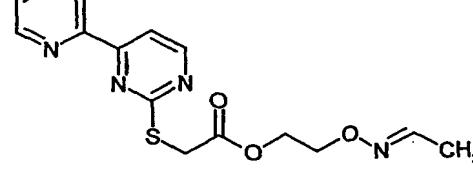
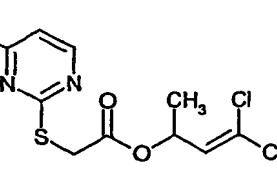
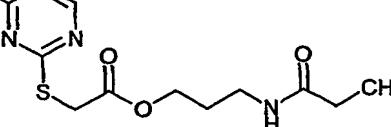
- 142 -

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
182			
183			
184			
185			
186		3.46	
187			
188		1.97	

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
189			
190		3.05	
191		2.02	
192		1.63	
193		2.46	
194		2.95	
195		2.72	

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
196		2.66	
197		1.79	
198		2.20	
199		2.64	
200		2.21	
201		1.02	
202			

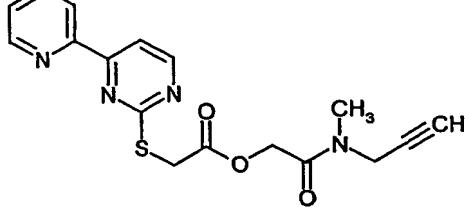
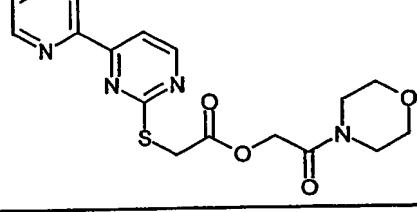
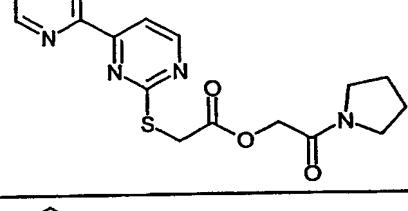
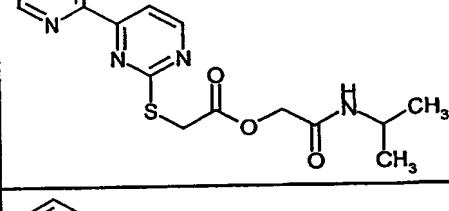
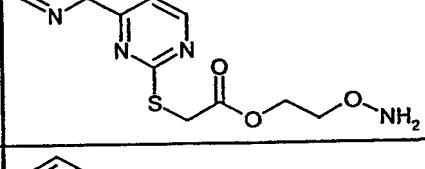
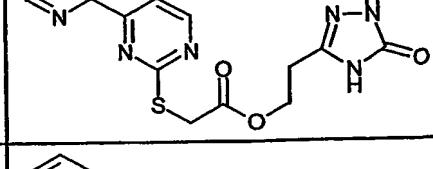
Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
203		2.78	
204		1.20	
205		3.81	
206		1.64	
207		2.61	
208			
209		1.32	

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
210		1.42	
211		2.75	
212		2.13	
213		1.42	
214		2.13	
215		3.48	
216		2.04	

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
217		1.40	
218			
219			
220		1.12	
221		3.00	
222		2.51	
223			

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
224		2.49	
225			
226			
227			
228			
229			
230		1.96	

- 150 -

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
237			
238			
239			
240			
241			
242			
243		3.20	

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
244			
245		2.19	
246		2.54	
247			
248		2.65	
249		1.69	
250		1.97	

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
251			
252		2.25	
253		3.19	
254		2.98	
255			
256		3.23	
257		3.48	

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
258			
259		2.69	
260			
261		1.62	
262		3.54	
263			

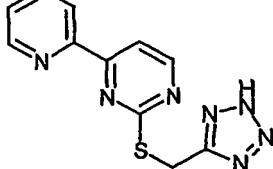
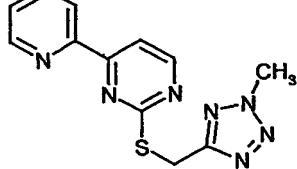
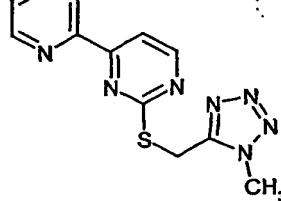
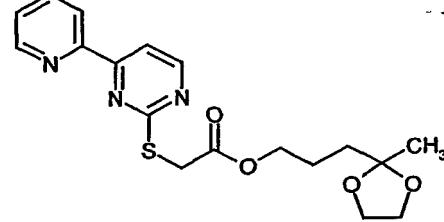
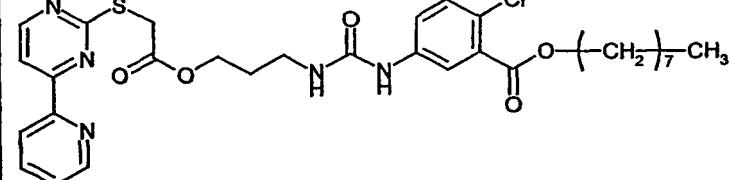
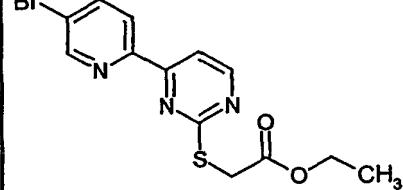
Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
264			
265		1.85	
266		2.22	
267			
268		1.34	
269		2.53	
270			

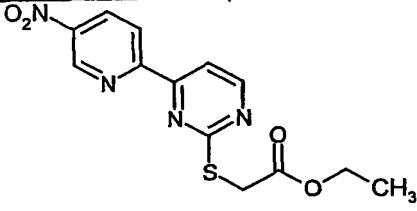
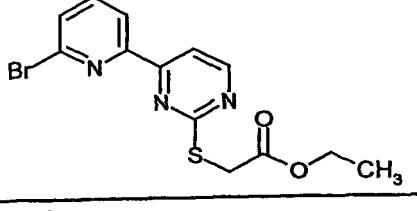
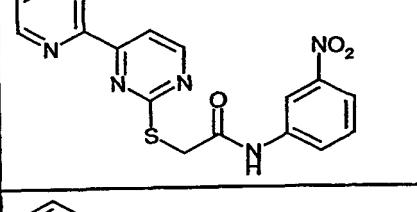
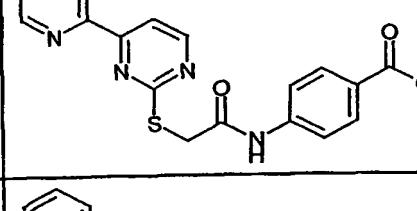
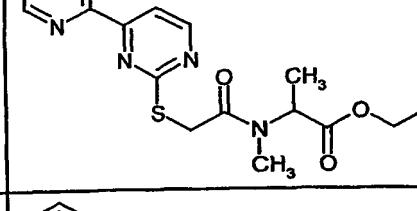
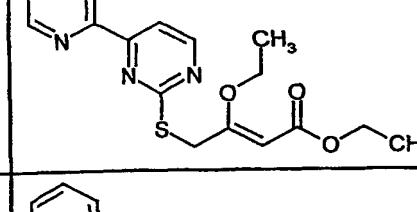
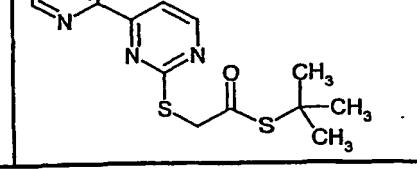
Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
271		2.18	64-65
272			
273			
274			
275			
276			
277			

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
278			
279			
280			
281		2.04	
282			
283			
284			

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
285			
286			
287			
288			
289			
290			
291			

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
292			
293			
294			
295			
296		3.49	
297			
298		2.51	

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
299		1.17	162
300		1.59	
301		1.24	
302		2.69	
303		2.57	
304		5.37	
305		3.39	

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
306		2.77	
307		3.31	
308		2.25	
309		2.16	
310		1.93	
311		3.39	
312		3.61	

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
313		2.28	
314		0.96	
315		2.13	
316		3.55	
317		1.68	
318			
319			

Nr.	Struktur	Log P (pH 2.3)	Fp./°C
320			

Die Bestimmung der angegebenen logP-Werte erfolgte gemäß EEC-Directive 79/831 Annex V.A8 durch HPLC (High Performance Liquid Chromatography) an einer Phasenumkehrsäule (C 18). Temperatur: 43°C.

Eluenten für die Bestimmung im sauren Bereich: 0,1 % wässrige Phosphorsäure, Acetonitril; linearer Gradient von 10 % Acetonitril bis 90 % Acetonitril.

10

Die Eichung erfolgte mit unverzweigten Alkan-2-onen (mit 3 bis 16 Kohlenstoffatomen), deren logP-Werte bekannt sind (Bestimmung der logP-Werte anhand der Retentionszeiten durch lineare Interpolation zwischen zwei aufeinanderfolgenden Alkanonen).

15

Die lambda-max-Werte wurden an Hand der UV-Spektren von 200 nm bis 400 nm in den Maxima der chromatographischen Signale ermittelt.

AnwendungsbeispieleBeispiel A5 **Aphis gossypii-Test**

Lösungsmittel: 30 Gewichtsteile Dimethylformamid
Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

10 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit emulgatorhaltigem Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15 Baumwollblätter (*Gossypium hirsutum*), die stark von der Baumwollblattlaus (*Aphis gossypii*) befallen sind, werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration behandelt.

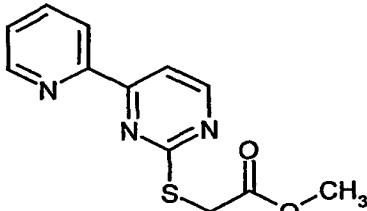
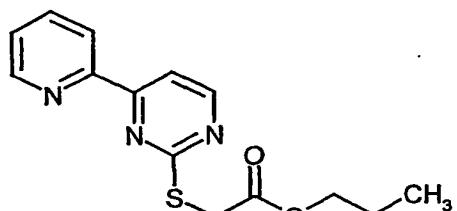
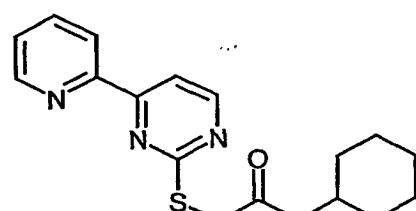
Nach der gewünschten Zeit wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %,
20 dass alle Blattläuse abgetötet wurden; 0 % bedeutet, dass keine Blattläuse abgetötet wurden.

Wirkstoffe, Wirkstoffkonzentration und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle hervor.

- 164 -

Tabelle A
pflanzenschädigende Insekten
Aphis gossypii-Test

5

Wirkstoffe	Wirkstoff konzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 6d
	200	85
	200	85
	200	90

Beispiel B**Franklinella-Test**

5 Lösungsmittel: 3 Gewichtsteile Dimethylformamid
 Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

10 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat auf die gewünschte Konzentration.

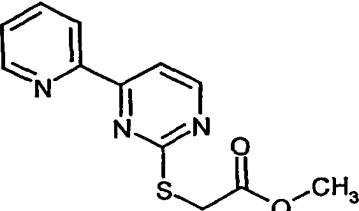
Gurkenpflanzen (*Cucumis sativus*), die stark von allen Stadien der Thripse (*Franklinella occidentalis*) befallen sind, werden mit einer Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration gespritzt.

15 Nach der gewünschten Zeit wird die Wirkung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, dass alle Thripse abgetötet wurden; 0 % bedeutet, dass keine Thripse abgetötet wurden.

20 Wirkstoffe, Wirkstoffkonzentration und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle hervor.

- 166 -

Tabelle B
pflanzenschädigende Insekten
Franklinella-Test

Wirkstoffe	Wirkstoff konzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 7d
	1000	99

5

Beispiel C**Meloidogyne-Test**

5 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

10 Gefäße werden mit Sand, Wirkstofflösung, Meloidogyne incognita-Ei-Larvensuspension und Salatsamen gefüllt. Die Salatsamen keimen und die Pflänzchen entwickeln sich. An den Wurzeln entwickeln sich die Gallen.

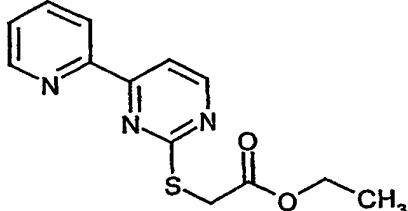
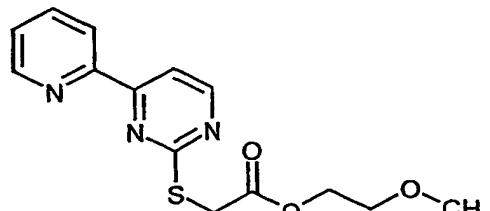
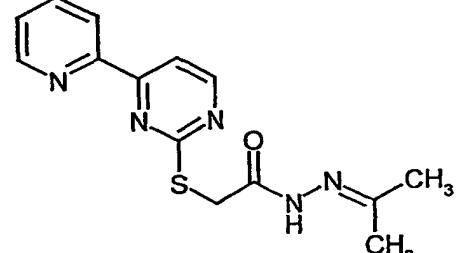
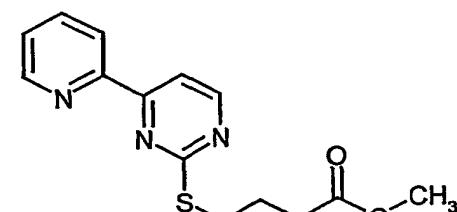
15 Nach der gewünschten Zeit wird die nematizide Wirkung an Hand der Gallenbildung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, dass keine Gallen gefunden wurden; 0 % bedeutet, dass die Zahl der Gallen an den behandelten Pflanzen der unbehandelten Kontrolle entspricht.

Lösungsmittelmenge und Emulgatormenge, Wirkstoffe, Wirkstoffkonzentration und Versuchsergebnisse gehen aus den folgenden Tabellen hervor.

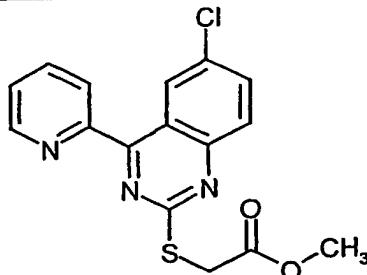
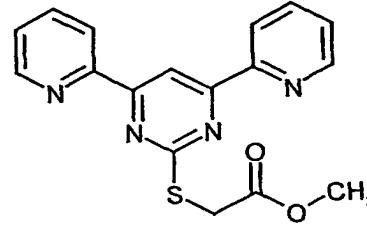
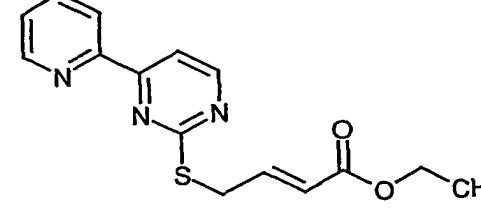
- 168 -

Tabelle C-1
pflanzenschädigende Nematoden
Meloidogyne -Test

Lösungsmittel: 30 Gewichtsteile Dimethylformamid
 5 Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

Wirkstoffe	Wirkstoff konzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 14d
	20	90
	20	90
	20	98
	20	90

- 169 -

Wirkstoffe	Wirkstoff konzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 14d
	20	98
	20	95
	20	100

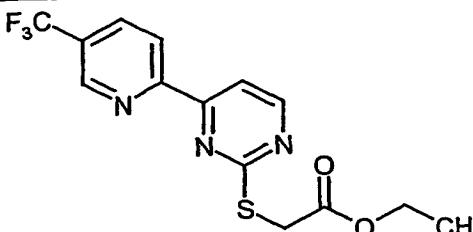
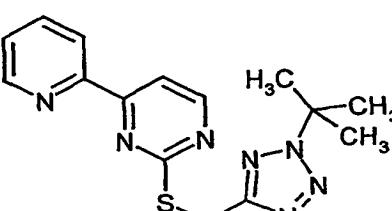
- 170 -

Tabelle C-2
 pflanzenschädigende Nematoden
Meloidogyne -Test

Lösungsmittel: 7 Gewichtsteile Dimethylformamid
 5 Emulgator: 2 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

Wirkstoffe	Wirkstoff konzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 14d
	20	80
	20	100
	20	90
	20	90

- 171 -

Wirkstoffe	Wirkstoff konzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 14d
	20	100
	20	90

Beispiel D**Myzus-Test**

5 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit emulgatorhaltigem Wasser auf die gewünschte Konzentration.

10 Kohlblätter (*Brassica oleracea*), die stark von der Pfirsichblattlaus (*Myzus persicae*) befallen sind, werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration behandelt.

15 Nach der gewünschten Zeit wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, dass alle Blattläuse abgetötet wurden; 0 % bedeutet, dass keine Blattläuse abgetötet wurden.

Lösungsmittelmenge und Emulgatormenge, Wirkstoffe, Wirkstoffkonzentration und Versuchsergebnisse gehen aus den folgenden Tabellen hervor.

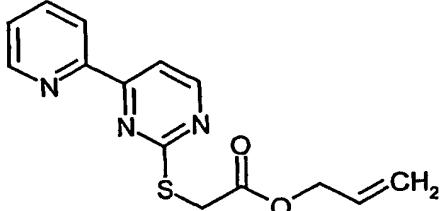
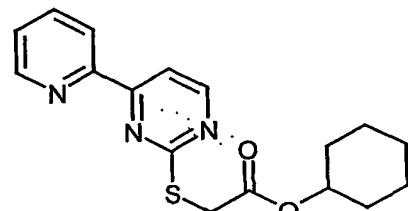
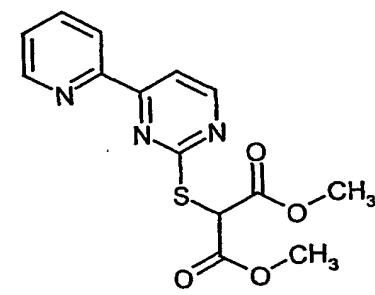
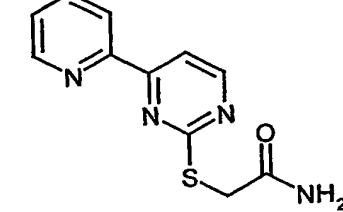
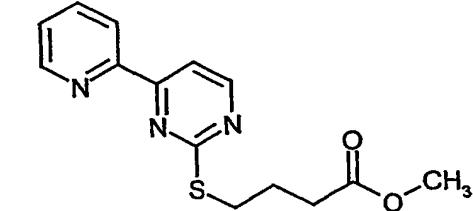
20

- 173 -

Tabelle D-1
pflanzenschädigende Insekten
Myzus- Test

Lösungsmittel: 30 Gewichtsteile Dimethylformamid
 5 Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

Wirkstoffe	Wirkstoff konzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 6d
	100	100
	1000	100
	1000	95
	1000	100

Wirkstoffe	Wirkstoff konzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 6d
	1000	95
	1000	100
	100	95
	1000	95
	1000	100

- 175 -

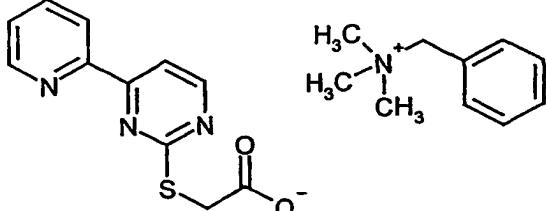
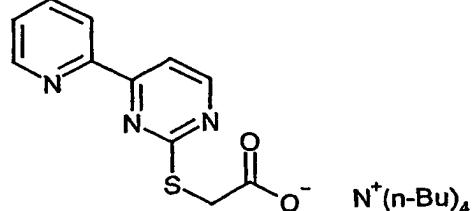
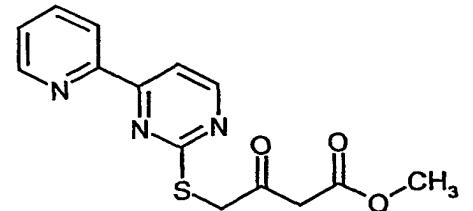
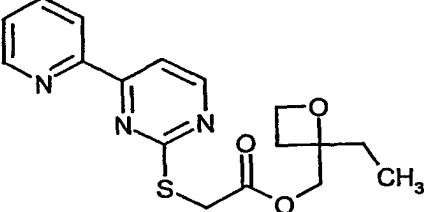
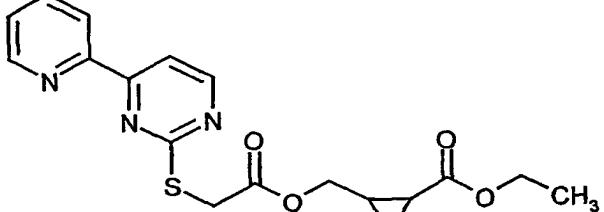
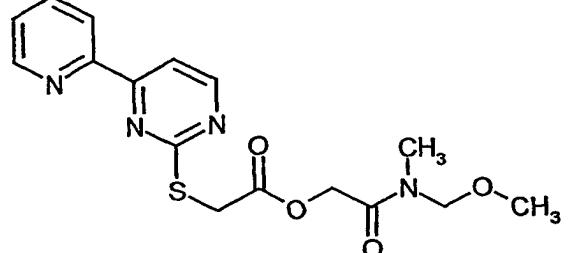
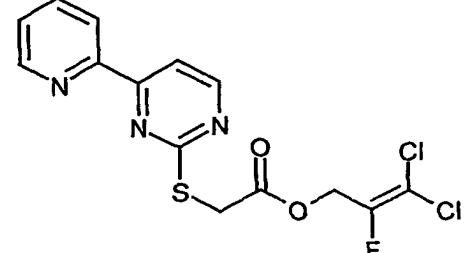
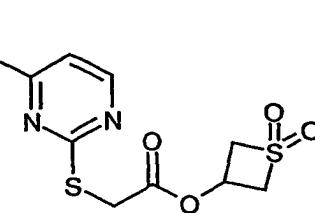
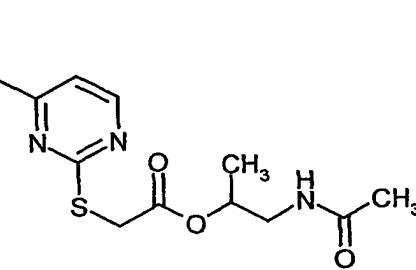
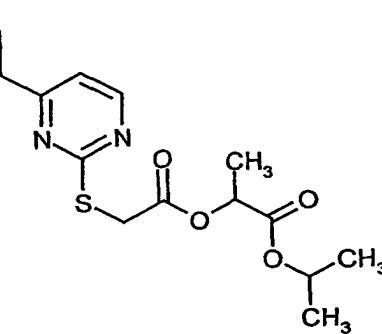
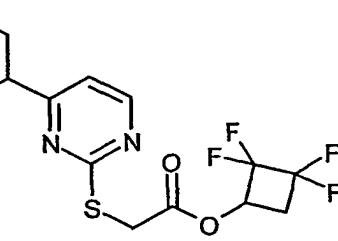
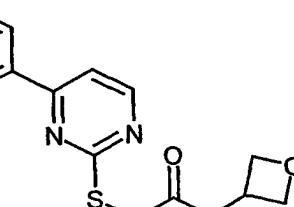
Wirkstoffe	Wirkstoff konzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 6d
	1000	100
	1000	100
	200	95

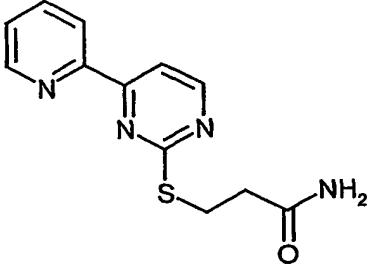
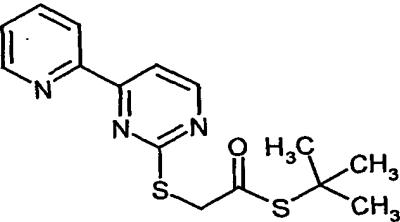
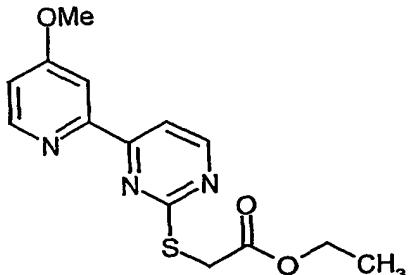
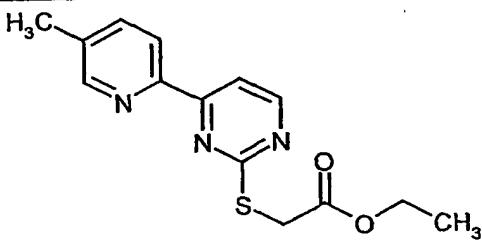
Tabelle D-2
pflanzenschädigende Insekten
Myzus- Test

Lösungsmittel: 7 Gewichtsteile Dimethylformamid
 5 Emulgator: 2 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

	Wirkstoffe	Wirkstoff konzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 6d
		500	98
		500	98
		500	98
		500	100

Wirkstoffe	Wirkstoff konzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 6d
	500	100
	500	95
	500	95
	500	100
	500	95

- 178 -

Wirkstoffe	Wirkstoff konzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 6d
	500	80
	500	95
	500	90
	500	98

Beispiel E**Phaedon-Larven-Test**

- 5 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit emulgatorhaltigem Wasser auf die gewünschte Konzentration.
- 10 Kohlblätter (*Brassica oleracea*) werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration behandelt und mit Larven des Meerrettichblattkäfers (*Phaedon cochleariae*) besetzt, solange die Blätter noch feucht sind.
- 15 Nach der gewünschten Zeit wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, dass alle Käferlarven abgetötet wurden; 0 % bedeutet, dass keine Käferlarven abgetötet wurden.

Lösungsmittelmenge und Emulgatormenge, Wirkstoffe, Wirkstoffkonzentration und Versuchsergebnisse gehen aus den folgenden Tabellen hervor.

20

- 180 -

Tabelle E-1
pflanzenschädigende Insekten
Phaedon-Larven-Test

Lösungsmittel: 30 Gewichtsteile Dimethylformamid
5 Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

Wirkstoffe	Wirkstoff konzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 7d
 The chemical structure is a complex molecule consisting of a 2-pyridyl group attached to a 4-(2-thienyl)-2H-imidazole ring. This ring is further substituted with a carbonyl group (C=O) and an N-hydroxyimino group (-NH-C(=O)-N(H)-). The imino group is linked to a 4-nitrophenyl group (-C6H4NO2).	1000	100

Tabelle E-2
pflanzenschädigende Insekten
Phaedon-Larven-Test

Lösungsmittel: 7 Gewichtsteile Dimethylformamid
 5 Emulgator: 2 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

Wirkstoffe	Wirkstoff konzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 7d
	500	100
	500	100
	500	100

Beispiel F**Spodoptera frugiperda-Test**

5 Lösungsmittel: 7 Gewichtsteile Dimethylformamid
Emulgator: 2 Gewichtsteile Alkylarylpolyglykolether

10 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Ge-
wichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und
verdünnt das Konzentrat mit emulgatorhaltigem Wasser auf die gewünschte Kon-
zentration.

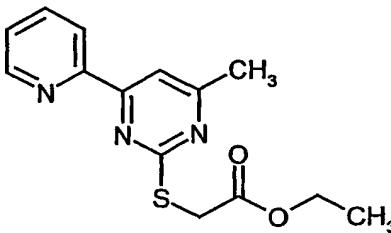
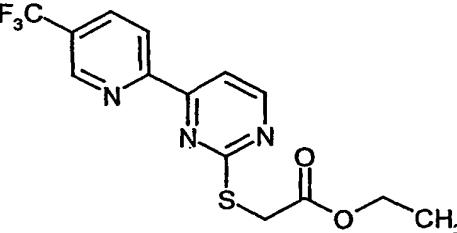
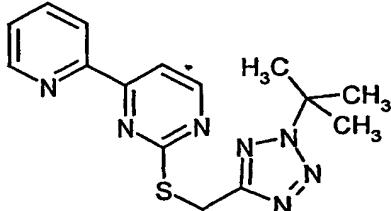
15 Kohlblätter (*Brassica oleracea*) werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung
der gewünschten Konzentration behandelt und mit Raupen des Heerwurms (*Spodo-*
ptera frugiperda) besetzt, solange die Blätter noch feucht sind.

Nach der gewünschten Zeit wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %,
dass alle Raupen abgetötet wurden; 0 % bedeutet, dass keine Raupen abgetötet
wurden.

20 Wirkstoffe, Wirkstoffkonzentration und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden
Tabelle hervor.

- 183 -

Tabelle F
 pflanzenschädigende Insekten
Spodoptera frugiperda -Test

Wirkstoffe	Wirkstoff konzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 7d
	500	100
	500	100
	500	100

Beispiel G**Diabrotica balteata – Test (Larven im Boden)****Grenzkonzentrations-Test / Bodeninsekten - Behandlung transgener Pflanzen**

5

Lösungsmittel: 7 Gewichtsteile Dimethylformamid

Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

10 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel, gibt die angegebene Menge Emulgator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15 Die Wirkstoffzubereitung wird auf den Boden gegossen. Dabei spielt die Konzentration des Wirkstoffs in der Zubereitung praktisch keine Rolle, entscheidend ist allein die Wirkstoffgewichtsmenge pro Volumeneinheit Boden, welche in ppm (mg/l) angegeben wird. Man füllt den Boden in 0,25 l Töpfe und lässt diese bei 20°C stehen.

20 Sofort nach dem Ansatz werden je Topf 5 vorgekeimte Maiskörner der Sorte YIELD GUARD (Warenzeichen von Monsanto Comp., USA) gelegt. Nach 2 Tagen werden in den behandelten Boden die entsprechenden Testinsekten gesetzt. Nach weiteren 7 Tagen wird der Wirkungsgrad des Wirkstoffs durch Auszählen der aufgelaufenen Maispflanzen bestimmt (1 Pflanze = 20% Wirkung).

Beispiel H**Heliothis virescens - Test (Behandlung transgener Pflanzen)**

5 Lösungsmittel: 7 Gewichtsteile Dimethylformamid
 Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

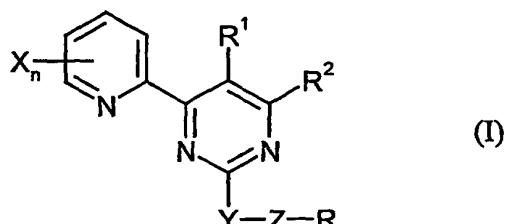
Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Ge-
wichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel und der angegebenen
10 Menge Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte
Konzentration.

15 Sojatriebe (Glycine max) der Sorte Roundup Ready (Warenzeichen der Monsanto
Comp. USA) werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung der gewünschten
Konzentration behandelt und mit der Tabakknospenraupe Heliothis virescens besetzt,
solange die Blätter noch feucht sind.

Nach der gewünschten Zeit wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %,
dass alle Raupen abgetötet wurden; 0 % bedeutet, dass keine Raupen abgetötet wur-
den.

Patentansprüche

1. Pyridylpyrimidine der Formel (I)



5

in welcher

R¹ und R² unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyano,
 Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogen-
 alkylthio, Alkenyl, Alkinyl, Alkenyloxy, Halogenalkenyloxy, Alki-
 nyloxy, Halogenalkinyloxy, -S(O)_pR³, -NR⁴R⁵, -COR⁶, -CO₂R⁷,
 -CSR⁶, -CONR⁴R⁵, -NHCO₂R⁸, Cycloalkyl; oder für gegebenenfalls
 10 substituiertes Aryl, Arylalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes Hetero-
 cyclyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff
 und Schwefel stehen,

15

R¹ und R² außerdem gemeinsam für Alkylen oder Alkenylen stehen, wobei
 die Kohlenstoffkette durch 1 bis 3 Heteroatome aus der Reihe Stick-
 stoff und Sauerstoff unterbrochen sein kann und der dadurch gebildete
 20 Ring wiederum gegebenenfalls durch Halogen oder Alkyl substituiert
 sein kann,

20

X für Halogen, Nitro, Cyano, Hydroxy, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy,
 Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Alkenyl, Alkinyl, Alke-
 nyloxy, Halogenalkenyloxy, Alkinyl, Halogenalkinyloxy,
 25 -S(O)_pR³, -NR⁴R⁵, -COR⁶, -CO₂R⁷, -CSR⁶, -CONR⁴R⁵, -NHCO₂R⁸,
 Cycloalkyl, Aryl, Arylalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes Hetero-
 ...

cycll mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel steht;

5 oder wenn n für 2, 3 oder 4 steht, zwei benachbarte Reste X außerdem gemeinsam für Alkylen oder Alkenylen stehen, wobei die Kohlenstoffkette durch 1 oder 2 Heteroatome aus der Reihe Stickstoff und Sauerstoff unterbrochen sein kann,

n für 0, 1, 2, 3 oder 4 steht, wobei X für gleiche oder verschiedene Reste steht, wenn n für 2, 3 oder 4 steht,

10 Y für eine direkte Bindung, Sauerstoff, $-S(O)_p-$ oder $-NR^9-$ steht,

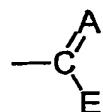
15 p für 0, 1 oder 2 steht,

Z für $-(CH_2)_r-$, $-(CH_2)_t-(CHR^{10})-(CH_2)_w-$, $-(CH_2)_r-C(O)-(CH_2)_t-$,
 $-(CH_2)_r-O-(CH_2)_t-$, $-(CH_2)_r-S(O)_p-(CH_2)_t-$, $-(CH_2)_r-N(R^{11})-(CH_2)_t-$
 oder $-(CH_2)_t-C(R^{12})=C(R^{13})-(CH_2)_w-$ steht,

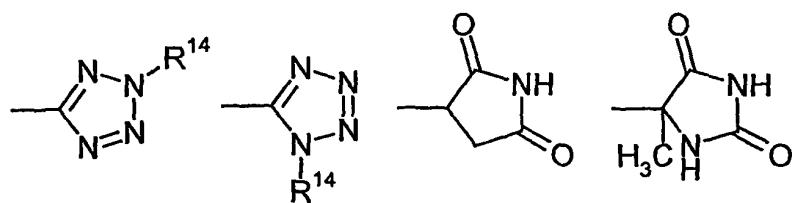
20 r für 1, 2, 3, 4, 5 oder 6 steht,

t und w unabhängig voneinander für 0, 1, 2, 3 oder 4 stehen,

25 R für die Gruppierung



oder für ein Carbonsäurebioisoster (Säuremimic), insbesondere aus der Gruppe



steht,

- A für Sauerstoff, Schwefel oder NR¹⁵ steht,
- 5 E für -OR¹⁶, -SR¹⁶, -O⁻M, -S⁻M oder -NR¹⁷R¹⁸ steht,
- M für gegebenenfalls durch Alkyl, Aryl oder Arylalkyl substituiertes Ammonium oder für ein Alkalimetallion steht,
- 10 M außerdem für ein Erdalkalimetallion steht, wobei jeweils zwei Moleküle einer Verbindung ein Salz mit einem solchen Ion bilden,
- 15 R³ für Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl; oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio substituiertes Aryl, Arylalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclylalkyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel steht,
- 20 R⁴ für Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl, Cycloalkyl oder Alkylcarbonyl steht,
- R⁵ für Wasserstoff, Amino, Formyl, Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Halogenalkyl, Cycloalkyl, Alkoxy, Alkoxyalkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl, Oxamoyl steht,

R⁴ und R⁵ außerdem gemeinsam für Alkylen; oder für gegebenenfalls durch Halogen, Nitro, Alkyl, Halogenalkyl substituiertes Benzyliden stehen;

- 5 R⁴ und R⁵ außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus stehen, der gegebenenfalls ein weiteres Stickstoff-, Sauerstoff- oder Schwefelatom enthalten kann und der gegebenenfalls durch Alkyl substituiert sein kann,
- 10 R⁶ für Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl oder Arylalkyl steht,
- 15 R⁷ für Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl, Aryl oder Arylalkyl steht,
- 20 R⁸ für Alkyl oder Halogenalkyl steht,
- 25 R⁹ für Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl; oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio substituiertes Aryl, Arylalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclylalkyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel steht,
- 30 R¹⁰ für Halogen, Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl; oder für Aryl oder Arylalkyl, welche ihrerseits im Arylteil durch Halogen oder Alkyl substituiert sein können, steht,
- 35 R¹¹ für Wasserstoff oder Alkyl steht,
- 40 R¹² und R¹³ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Hydroxy, Alkyl oder Alkoxy stehen,
- 45 R¹⁴ für Wasserstoff, Alkyl oder Halogenalkyl steht,

- R¹⁵ für Wasserstoff, Alkyl, Alkoxy, Cyano oder Dialkylamino steht,
- R¹⁶ für Wasserstoff; für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Alkoxycarbonyl, Alkenyloxycarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkenylcarbonyloxy, Oxyalkylenoxy, Oxetanyl, Dioxanyl, Oxazolidinyl, Dioxolanyl, Aryloxy, Halogenaryloxy, -CONR⁴R⁵, -NR⁴R⁵, -ONR⁴R⁵, -C(R¹⁴)=N-OR¹⁴ substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl; oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Alkoxycarbonyl, Alkylcarbonyloxy substituiertes Aryl, Arylalkyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocycl oder Heterocyclalkyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel; oder für -NR⁴R⁵ oder für einen der Reste Q steht,
- R¹⁶ außerdem für jeweils gegebenenfalls substituiertes Aryl, Arylalkyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocycl oder Heterocyclalkyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel steht, wobei die Substituenten zusätzlich zu den oben genannten aus Hydroxy und Nitro ausgewählt werden können,
- R¹⁷ für Wasserstoff oder Alkyl steht,
- R¹⁸ für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, Alkyl, Alkenyl; oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Hydroxy, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Oxyalkylenoxy substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl, Aryl, Arylalkyl, Heteroaryl oder Heteroarylalkyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel; oder für -S(O)_pR³, -OR¹⁴ oder -NR⁴R⁵ steht,

R¹⁸ außerdem für jeweils gleich oder verschieden durch Halogen, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Alkoxycarbonyl, Alkenyloxycarbonyl substituiertes Alkyl oder Alkenyl steht,

5

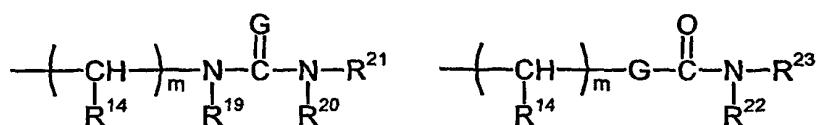
R¹⁸ außerdem für jeweils gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl, Aryl, Arylalkyl, Heteroaryl oder Heteroarylalkyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel steht, wobei die Substituenten zusätzlich zu den oben genannten aus Nitro und Alkoxycarbonyl ausgewählt werden können,

10

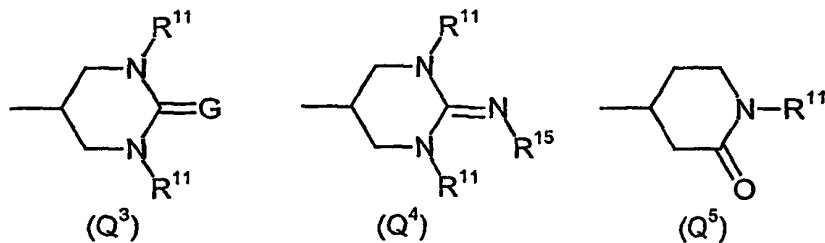
R¹⁷ und R¹⁸ außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen 5- oder 6-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus, der 1 bis 2 weitere Heteroatome aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel enthalten kann und der gegebenenfalls durch Alkyl substituiert sein kann, stehen,

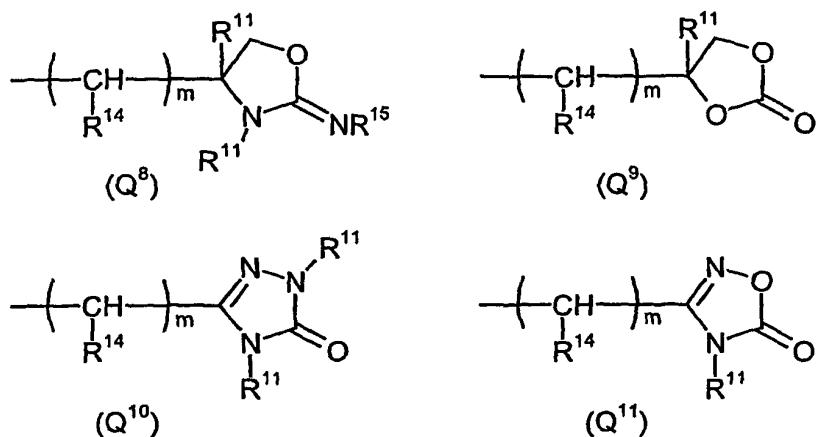
15

Q für eine der folgenden Gruppierungen



20





steht, wobei die Reste R¹¹ die gleiche oder verschiedene Bedeutungen haben können, wenn sie mehrfach in derselben heterocyclischen Gruppierung vorkommen,

10 m für 0, 1, 2 oder 3 steht, wobei die Wiederholungseinheit -(CHR¹⁴)- innerhalb der Seitenkette einer heterocyclischen Gruppierung die gleiche oder verschiedene Bedeutungen haben kann, wenn m für 2 oder 3 steht,

G für Sauerstoff oder Schwefel steht,

15 R¹⁹ und R²⁰ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Alkyl oder gemeinsam
für Alkylen stehen,

R²¹ für Wasserstoff, für gegebenenfalls durch Alkylcarbonyloxy oder
Alkoxy substituiertes Alkyl; oder für gegebenenfalls durch Halogen,
Cyano, Alkyl, Halogenalkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl, Alkylen
substituiertes Aryl steht,

R²² für Wasserstoff, Alkyl oder Alkoxyalkyl steht,

25 R²³ für Wasserstoff, Amino, Alkyl oder Alkoxyalkyl steht.

2. Pyridylpyrimidine der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher

- 5 R¹⁶ für Wasserstoff; für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Alkoxycarbonyl, Alkenyloxycarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkenylcarbonyloxy, Oxyalkylenoxy, Oxetanyl, Dioxanyl, Oxazolidinyl, Dioxolanyl, Aryloxy, Halogenaryloxy, -CONR⁴R⁵, -NR⁴R⁵, -ONR⁴R⁵, -C(R¹⁴)=N-OR¹⁴ substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl; oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Alkoxycarbonyl, Alkylcarbonyloxy substituiertes Aryl, Arylalkyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocycl oder Heterocyclalkyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel; oder für -NR⁴R⁵ oder für einen der Reste Q steht,
- 10 15 R¹⁸ für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, Alkyl, Alkenyl; oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Hydroxy, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Oxyalkylenoxy substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl, Aryl, Arylalkyl, Heteroaryl oder Heteroarylalkyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel; oder für -S(O)_pR³, -OR¹⁴ oder -NR⁴R⁵ steht.

3. Pyridylpyrimidine der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher

- 25 R¹ und R² unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, C₂-C₆-Alkenyloxy, C₂-C₆-Halogenalkenyloxy, C₂-C₆-Alkinyloxy, C₂-C₆-Halogenalkinyloxy, -S(O)_pR³, -NR⁴R⁵, -COR⁶, -CO₂R⁷, -CSR⁶, -CONR⁴R⁵, -NHCO₂R⁸, C₃-C₇-Cycloalkyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden

- 5 durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy substituiertes Aryl, Aryl-C₁-C₆-alkyl oder 5- oder 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl, welches 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthält, stehen,
- 10 R¹ und R² außerdem gemeinsam für C₃-C₅-Alkylen oder C₃-C₄-Alkenylen stehen, wobei die Kohlenstoffkette durch 1 oder 2 Heteroatome, welche 0 bis 2 Stickstoffatome und/oder 0 oder 1 Sauerstoffatom sein können, unterbrochen sein kann und der dadurch gebildete Ring wiederum gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C₁-C₆-Alkyl substituiert sein kann,
- 15 X für Halogen, Nitro, Cyano, Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, C₂-C₆-Alkenyloxy, C₂-C₆-Halogenalkenyloxy, C₂-C₆-Alkinyloxy, C₂-C₆-Halogenalkinyloxy, -S(O)_pR³, -NR⁴R⁵, -COR⁶, -CO₂R⁷, -CSR⁶, -CONR⁴R⁵, -NHCO₂R⁸, C₃-C₇-Cycloalkyl, Aryl, Aryl-C₁-C₆-alkyl, 5- oder 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes, Heterocyclyl, welches 0 bis 4 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthält, steht;
- 20 oder wenn n für 2 oder 3 steht, zwei benachbarte Reste X außerdem gemeinsam für C₃-C₅-Alkylen oder C₃-C₄-Alkenylen stehen, wobei die Kohlenstoffkette durch 1 oder 2 Heteroatome, welche 0 bis 2 Stickstoffatome und/oder 0 oder 1 Sauerstoffatom sein können, unterbrochen sein kann,
- 25 n für 0, 1, 2 oder 3 steht, wobei X für gleiche oder verschiedene Reste steht, wenn n für 2 oder 3 steht,

Y für eine direkte Bindung, Sauerstoff, $-S(O)_p$ - oder $-NR^9$ - steht,

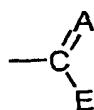
p für 0, 1 oder 2 steht,

5 Z für $-(CH_2)_r$, $-(CH_2)_t-(CHR^{10})-(CH_2)_w$, $-(CH_2)_r-C(O)-(CH_2)_t$,
 $-(CH_2)_r-O-(CH_2)_t$, $-(CH_2)_r-S(O)_p-(CH_2)_t$, $-(CH_2)_r-N(R^{11})-(CH_2)_t$
oder $-(CH_2)_t-C(R^{12})=C(R^{13})-(CH_2)_w$ steht,

r für 1, 2, 3, 4, 5 oder 6 steht,

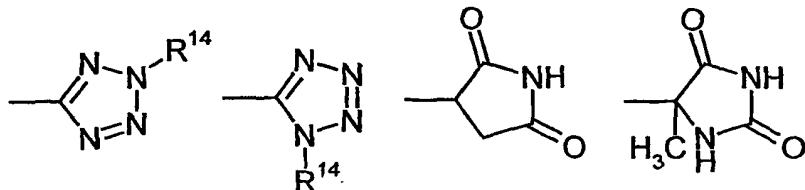
10 t und w unabhängig voneinander für 0, 1, 2, 3 oder 4 stehen,

R für die Gruppierung



15

oder für ein Carbonsäurebioisoster (Säuremimic), insbesondere aus der Gruppe



20

steht,

A für Sauerstoff, Schwefel oder NR^{15} steht,

E für $-OR^{16}$, $-SR^{16}$, $-O^-M$, $-S^-M$ oder $-NR^{17}R^{18}$ steht,

25

M für gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch C_1-C_6 -Alkyl, Aryl oder Aryl- C_1-C_6 -alkyl substituiertes Ammonium

oder für ein Lithiumkation (Li^+), ein Natriumkation (Na^+) oder ein Kaliumkation (K^+) steht,

- M außerdem für ein Magnesiumkation (Mg^{2+}) oder ein Calciumkation (Ca^{2+}) steht, wobei jeweils zwei Moleküle einer Verbindung ein Salz mit einem solchen Ion bilden,
5
- R³ für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl-C₁-C₆-alkyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfache oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio substituiertes Aryl, Aryl-C₁-C₆-alkyl, 5- oder 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C₁-C₆-alkyl, welche jeweils 0 bis 4
10 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten, steht,
15
- R⁴ für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl steht,
20
- R⁵ für Wasserstoff, Amino, Formyl, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl, Oxamoyl steht,
25
- R⁴ und R⁵ außerdem gemeinsam für C₁-C₆-Alkyldien; oder für gegebenenfalls einfache oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Nitro, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl substituiertes Benzyliden stehen,
30
- R⁴ und R⁵ außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen 5- oder 6-gliedrigen, gesättigten oder

ungesättigten Heterocylus stehen, der gegebenenfalls ein weiteres Stickstoff-, Sauerstoff- oder Schwefelatom enthalten kann und der gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch C₁-C₆-Alkyl substituiert sein kann,

5

R⁶ für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl oder Aryl-C₁-C₆-alkyl steht,

10

R⁷ für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl-C₁-C₆-alkyl, Aryl oder Aryl-C₁-C₆-alkyl steht,

R⁸ für C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Halogenalkyl steht,

15

R⁹ für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl-C₁-C₆-alkyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio substituiertes Aryl, Aryl-C₁-C₆-alkyl, 5- oder 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C₁-C₆-alkyl, welche jeweils 0 bis 4 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten, steht,

20

25

R¹⁰ für Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₁-C₆-Alkoxy carbonyl, C₃-C₇-Cycloalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl-C₁-C₆-alkyl; oder für Aryl oder Aryl-C₁-C₆-alkyl, welche ihrerseits im Arylteil einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C₁-C₆-Alkyl substituiert sein können, steht,

30

R¹¹ für Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl steht,

R¹² und R¹³ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Alkoxy stehen,

R¹⁴ für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Halogenalkyl steht,

5

R¹⁵ für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, Cyano oder Di(C₁-C₆-alkyl)amino steht,

R¹⁶ für Wasserstoff; für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, C₂-C₆-Alkenyloxycarbonyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyloxy, C₂-C₆-Alkenylcarbonyloxy, Oxy(C₁-C₆-alkylen)oxy, Oxetanyl, Dioxanyl, Oxazolidinyl, Dioxolanyl, Aryloxy, Halogenaryloxy, -CONR⁴R⁵, -NR⁴R⁵, -ONR⁴R⁵, -C(R¹⁴)=N-OR¹⁴ substituiertes C₁-C₁₆-Alkyl, C₂-C₁₀-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyloxy substituiertes Aryl, Aryl-C₁-C₆-alkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl-C₁-C₆-alkyl, 4- bis 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C₁-C₆-alkyl, welche jeweils 0 bis 4 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten; oder für -NR⁴R⁵ oder für einen der Reste Q steht,

R¹⁶ außerdem für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden substituiertes Aryl, Aryl-C₁-C₆-alkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl-C₁-C₆-alkyl, 4- bis 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C₁-C₆-alkyl, welche jeweils 0 bis 4 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte

Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten, steht, wobei die Substituenten zusätzlich zu den oben genannten aus Hydroxy und Nitro ausgewählt werden können,

- 5 R¹⁷ für Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl steht,
- 10 R¹⁸ für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, Oxy(C₁-C₆-alkylen)oxy substituiertes C₃-C₇-Cycloalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl-C₁-C₆-alkyl, Aryl, Aryl-C₁-C₆-alkyl, Heteroaryl oder Heteroaryl-C₁-C₆-alkyl welche jeweils 0 bis 4 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten; oder für -S(O)_pR³, -OR¹⁴ oder -NR⁴R⁵ steht,
- 15 R¹⁸ außerdem für jeweils einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, C₂-C₆-Alkenyloxycarbonyl substituiertes C₁-C₆-Alkyl oder C₂-C₆-Alkenyl steht,
- 20 R¹⁸ außerdem für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden substituiertes C₃-C₇-Cycloalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl-C₁-C₆-alkyl, Aryl, Aryl-C₁-C₆-alkyl, Heteroaryl oder Heteroaryl-C₁-C₆-alkyl welche jeweils 0 bis 4 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten, steht, wobei die Substituenten zusätzlich zu den oben genannten aus Nitro und C₁-C₆-Alkoxycarbonyl ausgewählt werden können,
- 25 R¹⁸ außerdem für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden substituiertes C₃-C₇-Cycloalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl-C₁-C₆-alkyl, Aryl, Aryl-C₁-C₆-alkyl, Heteroaryl oder Heteroaryl-C₁-C₆-alkyl welche jeweils 0 bis 4 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten, steht, wobei die Substituenten zusätzlich zu den oben genannten aus Nitro und C₁-C₆-Alkoxycarbonyl ausgewählt werden können,
- 30 R¹⁸ außerdem für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden substituiertes C₃-C₇-Cycloalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl-C₁-C₆-alkyl, Aryl, Aryl-C₁-C₆-alkyl, Heteroaryl oder Heteroaryl-C₁-C₆-alkyl welche jeweils 0 bis 4 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten, steht, wobei die Substituenten zusätzlich zu den oben genannten aus Nitro und C₁-C₆-Alkoxycarbonyl ausgewählt werden können,

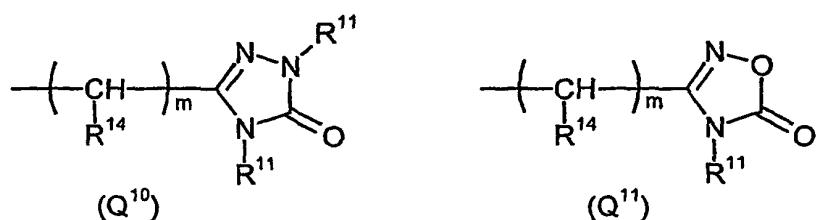
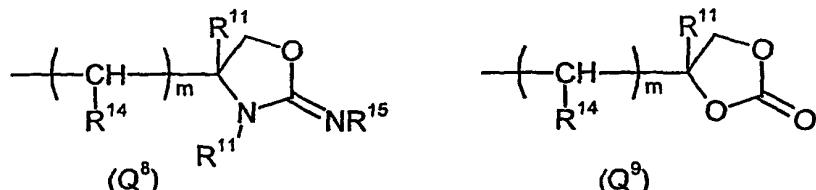
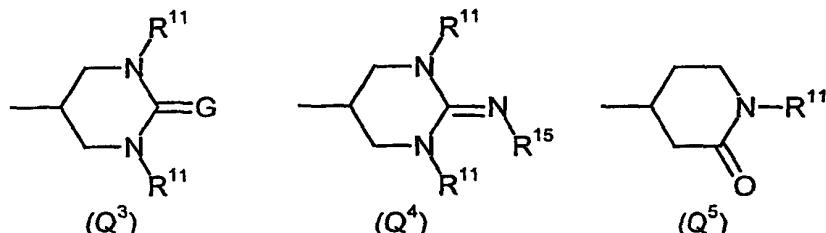
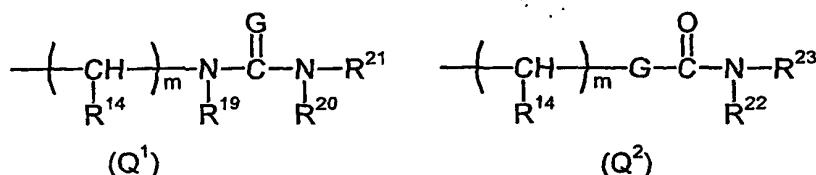
- 200 -

R¹⁷ und R¹⁸ außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen 5- oder 6-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus, der 1 oder 2 weitere Heteroatome enthalten kann, welche 0 bis 2 Stickstoffatome, 0 oder 1 Sauerstoffatom und/oder 0 oder 1 Schwefelatom sein können, und der gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch C₁-C₆-Alkyl substituiert sein kann, stehen,

5

10

Q für eine der folgenden Gruppierungen



15

steht, wobei die Reste R¹¹ die gleiche oder verschiedene Bedeutungen haben können, wenn sie mehrfach in derselben heterocyclischen Gruppierung vorkommen,

5 m für 0, 1, 2 oder 3 steht, wobei die Wiederholungseinheit -(CHR¹⁴)- innerhalb der Seitenkette einer heterocyclischen Gruppierung die gleiche oder verschiedene Bedeutungen haben kann, wenn m für 2 oder 3 steht,

10 G für Sauerstoff oder Schwefel steht,

R¹⁹ und R²⁰ unabhängig voneinander für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl oder gemeinsam für C₂-C₄-Alkylen stehen,

15 R²¹ für Wasserstoff, für gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch C₁-C₆-Alkylcarbonyloxy oder C₁-C₆-Alkoxy substituiertes C₁-C₆-Alkyl; oder für gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₁-C₁₀-Alkoxycarbonyl, C₃-C₅-Alkylen substituiertes Aryl steht,

20

R²² für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl steht,

25

R²³ für Wasserstoff, Amino, C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl steht.

4. Pyridylpyrimidine der Formel (I) gemäß Anspruch 3, in welcher

30 R¹⁶ für Wasserstoff; für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, C₂-C₆-Alkenyloxycar-

bonyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyloxy, C₂-C₆-Alkenylcarbonyloxy, Oxy(C₁-C₆-alkylen)oxy, Oxetanyl, Dioxanyl, Oxazolidinyl, Dioxolanyl, Aryloxy, Halogenaryloxy, -CONR⁴R⁵, -NR⁴R⁵, -ONR⁴R⁵, -C(R¹⁴)=N-OR¹⁴ substituiertes C₁-C₁₆-Alkyl, C₂-C₁₀-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alcoxycarbonyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyloxy substituiertes Aryl, Aryl-C₁-C₆-alkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl-C₁-C₆-alkyl, 4- bis 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocycl oder Heterocycl-C₁-C₆-alkyl, welche jeweils 0 bis 4 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten; oder für -NR⁴R⁵ oder für einen der Reste Q steht,

15 R¹⁸ für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, Oxy(C₁-C₆-alkylen)oxy substituiertes C₃-C₇-Cycloalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl-C₁-C₆-alkyl, Aryl, Aryl-C₁-C₆-alkyl, Heteroaryl oder Heteroaryl-C₁-C₆-alkyl welche jeweils 0 bis 4 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten; oder für -S(O)_pR³, -OR¹⁴ oder -NR⁴R⁵ steht.

5. Pyridylpyrimidine der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher

R¹ und R² unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkylthio,

- 5 C₁-C₄-Halogenalkylthio mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₂-C₄-Alkenyl, C₂-C₄-Alkinyl, -S(O)_pR³, -NR⁴R⁵, -COR⁶, -CO₂R⁷, -CSR⁶, -CONR⁴R⁵, -NHCO₂R⁸, C₃-C₆-Cycloalkyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden
- 10 durch Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen substituiertes Aryl, Aryl-C₁-C₄-alkyl, 5- oder 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes, Heterocycl, welches 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthält, stehen,
- .15 R¹ und R² außerdem gemeinsam für C₃-C₅-Alkylen oder C₃-C₄-Alkenylen, wobei die Kohlenstoffkette durch 1 oder 2 Heteroatome, welche 0 bis 2 Stickstoffatome und/oder 0 oder 1 Sauerstoffatom sein können, unterbrochen sein kann und der dadurch gebildete Ring wiederum gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom oder C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann, stehen,
- 20 X für Fluor, Chlor, Brom, Nitro, Cyano, Hydroxy, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₂-C₄-Alkenyl, C₂-C₄-Alkinyl, -S(O)_pR³, -NR⁴R⁵, -COR⁶, -CO₂R⁷, -CSR⁶, -CONR⁴R⁵, -NHCO₂R⁸, C₃-C₆-Cycloalkyl, Aryl, Aryl-C₁-C₄-alkyl, 5- oder 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes, Heterocycl, welches 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthält, steht,
- 25 oder wenn n für 2 steht, zwei benachbarte Reste X außerdem gemeinsam für C₃-C₄-Alkylen oder C₃-C₄-Alkenylen steht, wobei die Koh-
- 30

lenstoffkette durch 1 oder 2 Heteroatome, welche 0 bis 2 Stickstoffatome und/oder 0 oder 1 Sauerstoffatom sein können, unterbrochen sein kann,

5 n für 0, 1 oder 2 steht, wobei X für gleiche oder verschiedene Reste steht, wenn n für 2 steht,

Y für eine direkte Bindung, Sauerstoff, $-S(O)_p-$ oder $-NR^9-$ steht,

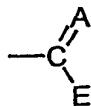
10 p für 0, 1 oder 2 steht,

Z für $-(CH_2)_r-$, $-(CH_2)_t-(CHR^{10})-(CH_2)_w-$, $-(CH_2)_r-C(O)-(CH_2)_t-$,
 $-(CH_2)_r-O-(CH_2)_t-$, $-(CH_2)_r-S(O)_p-(CH_2)_t-$, $-(CH_2)_r-N(R^{11})-(CH_2)_t-$
oder $-(CH_2)_t-C(R^{12})=C(R^{13})-(CH_2)_w-$ steht,

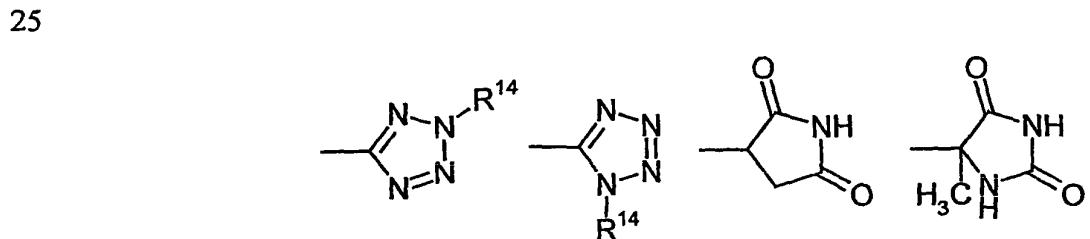
15 r für 1, 2, 3 oder 4 steht,

t und w unabhängig voneinander für 0, 1, 2, 3 oder 4 stehen,

20 R für die Gruppierung



oder für ein Carbonsäurebioisoster (Säuremimic), insbesondere aus der Gruppe



steht,

- A für Sauerstoff oder Schwefel steht,
- E für -OR¹⁶, -SR¹⁶, -O-M, -S-M oder -NR¹⁷R¹⁸ steht,
- 5 M für gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch C₁-C₄-Alkyl, Phenyl, Benzyl oder Phenylethyl substituiertes Ammonium oder für ein Natriumkation (Na⁺) oder ein Kaliumkation (K⁺) steht,
- 10 M außerdem für ein Magnesiumkation (Mg²⁺) oder ein Calciumkation (Ca²⁺) steht, wobei jeweils zwei Moleküle einer Verbindung ein Salz mit einem solchen Ion bilden,
- 15 R³ für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder
- 20 25 Bromatomen, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen substituiertes Aryl, Aryl-C₁-C₄-alkyl, 5- oder 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C₁-C₄-alkyl, welches 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten, steht,
- R⁴ für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkyl-carbonyl steht,
- 30 R⁵ für Wasserstoff, Amino, Formyl, C₁-C₄-Alkyl, C₂-C₄-Alkenyl, C₂-C₄-Alkinyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder

Bromatomen, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylcarbonyl, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl, Oxamoyl steht,

- 5 R⁴ und R⁵ außerdem gemeinsam für C₁-C₄-Alkyliden; oder für gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen substituiertes Benzyliden steht,
- 10 R⁴ und R⁵ außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen 5- oder 6-gliedrigen, gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus, der gegebenenfalls ein weiteres Stickstoff-, Sauerstoff- oder Schwefelatom enthalten kann und der gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann, steht,
- 15 R⁶ für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen oder Aryl-C₁-C₄-alkyl steht,
- 20 R⁷ für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, Aryl oder Aryl-C₁-C₄-alkyl steht,
- 25 R⁸ für C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen steht,
- 30 R⁹ für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder

5 Bromatomen, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio mit 1 bis 9
Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen substituiertes Aryl, Aryl-C₁-C₄-
alkyl, 5- oder 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl
oder Heterocyclyl-C₁-C₄-alkyl, welche 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2
nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte
Schwefelatome enthalten, steht,

10 R¹⁰ für Fluor, Chlor, Brom, Iod, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkylcarbonyl, C₁-C₄-Alkoxy carbonyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl; oder für Aryl oder Aryl-C₁-C₄-alkyl, welche ihrerseits im Aryl- teil einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom oder C₁-C₄-Alkyl substituiert sein können, steht,

R¹¹ für Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl steht,
15
R¹² und R¹³ unabhängig voneinander für Wass
oder C₁-C₄-Alkoxy stehen,

R¹⁴ für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9
Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen steht,

R¹⁵ für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, Cyano oder Di(C₁-C₄-alkyl)amino steht,

25 R¹⁶ für Wasserstoff; für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkoxy carbonyl, C₂-C₄-Alkenyloxycarbonyl, C₁-C₄-Alkylcarbonyloxy, C₂-C₄-Alkenylcarbonyloxy, Oxy(C₁-C₄-alkylen)oxy, Oxetanyl, Dioxanyl, Oxazolidinyl, Dioxolanyl, Aryloxy, Halogenaryloxy, -CONR⁴R⁵, -NR⁴R⁵,

30

-
- 5 $\text{-ONR}^4\text{R}^5$, $\text{-C(R}^{14}\text{)=N-OR}^{14}$ substituiertes $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-Alkyl}$, Decyl, Dodecyl, Tetradecyl, Hexadecyl, $\text{C}_2\text{-C}_6\text{-Alkenyl}$, Decenyl, $\text{C}_2\text{-C}_4\text{-Alkinyl}$; oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-Alkyl}$, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-Halogenalkyl}$ mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-Alkoxy}$, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-Halogenalkoxy}$ mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-Alkylthio}$, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-Halogenalkylthio}$ mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-Alkoxycarbonyl}$, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-Alkylcarbonyloxy}$ substituiertes Aryl, Aryl- $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl}$, $\text{C}_3\text{-C}_6\text{-Cycloalkyl}$, $\text{C}_3\text{-C}_6\text{-Cycloalkyl-C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl}$, 4- bis 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes, Heterocyclyl oder Heterocyclyl- $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl}$, welche jeweils 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten; oder für einen der Reste Q steht,
- 10 15 R¹⁶ außerdem für jeweils gegebenenfalls bis zur maximal möglichen Zahl, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor und/oder Brom substituiertes $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-Alkyl}$, Decyl, Dodecyl, Tetradecyl, Hexadecyl, $\text{C}_2\text{-C}_6\text{-Alkenyl}$, Decenyl, $\text{C}_2\text{-C}_4\text{-Alkinyl}$ steht,
- 20 25 R¹⁶ außerdem für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden substituiertes Aryl, Aryl- $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl}$, $\text{C}_3\text{-C}_6\text{-Cycloalkyl}$, $\text{C}_3\text{-C}_6\text{-Cycloalkyl-C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl}$, 4- bis 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes, Heterocyclyl oder Heterocyclyl- $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl}$, welche jeweils 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten steht, wobei die Substituenten zusätzlich zu den oben genannten aus Hydroxy und Nitro ausgewählt werden können,
- 30 R¹⁷ für Wasserstoff oder $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-Alkyl}$ steht,

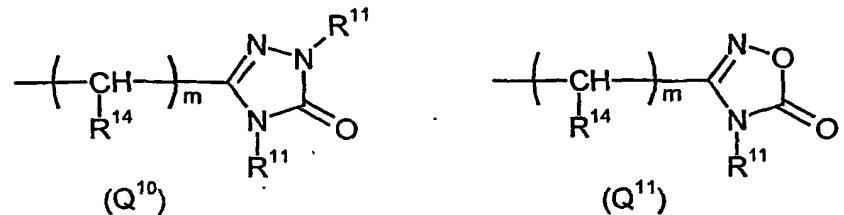
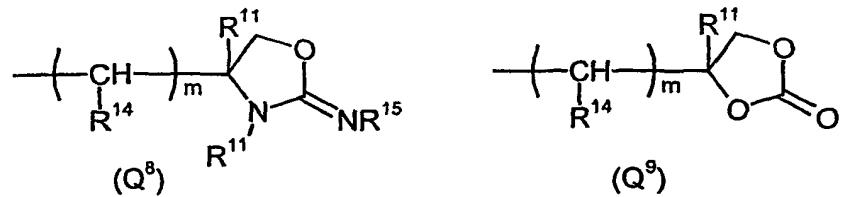
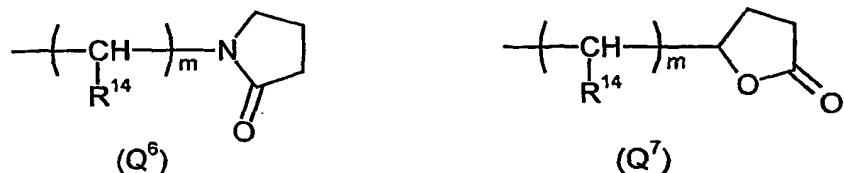
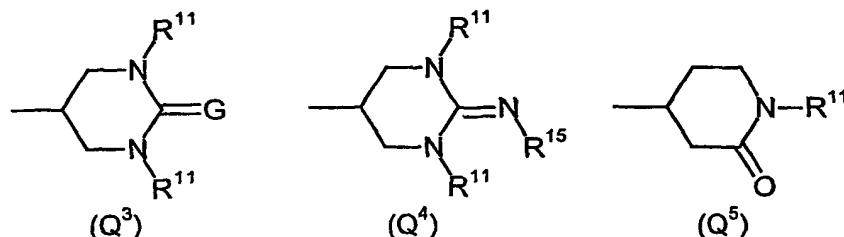
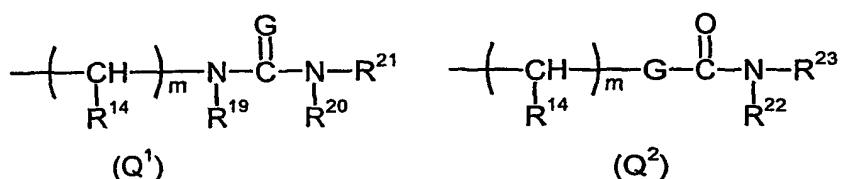
- 5 R¹⁸ für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, C₁-C₄-Alkyl, C₂-C₄-Alkenyl; oder
 für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder
 verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Hydroxy, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-
 Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-
 Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder
 Bromatomen, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio mit 1 bis 9
 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, Oxy(C₁-C₄-alkylen)oxy
 substituiertes C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, Aryl,
 Aryl-C₁-C₄-alkyl, Heteroaryl oder Heteroaryl-C₁-C₄-alkyl, welche
 jeweils 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte
 Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome
 enthalten; oder für -S(O)_pR³, -OR¹⁴ oder -NR⁴R⁵ steht,
- 10 R¹⁸ außerdem für jeweils einfach bis vierfach, gleich oder verschieden
 durch Fluor, Chlor, Brom, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, C₁-C₄-
 Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder
 Bromatomen, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio mit 1 bis 9
 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl, C₂-C₄-
 Alkenyloxycarbonyl substituiertes C₁-C₄-Alkyl oder C₂-C₄-Alkenyl;
 oder für jeweils gegebenenfalls bis zur maximal möglichen Zahl,
 gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor und/oder Brom substituier-
 tes C₁-C₄-Alkyl oder C₂-C₄-Alkenyl steht,
- 15 R¹⁸ außerdem für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder
 verschieden substituiertes C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-
 C₄-alkyl, Aryl, Aryl-C₁-C₄-alkyl, Heteroaryl oder Heteroaryl-C₁-C₄-
 alkyl, welche jeweils 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benach-
 barte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefel-
 atome enthalten steht, wobei die Substituenten zusätzlich zu den oben
 genannten aus Nitro und C₁-C₆-Alkoxycarbonyl ausgewählt werden
 können,
- 20 R¹⁸ außerdem für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder
 verschieden substituiertes C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-
 C₄-alkyl, Aryl, Aryl-C₁-C₄-alkyl, Heteroaryl oder Heteroaryl-C₁-C₄-
 alkyl, welche jeweils 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benach-
 barte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefel-
 atome enthalten steht, wobei die Substituenten zusätzlich zu den oben
 genannten aus Nitro und C₁-C₆-Alkoxycarbonyl ausgewählt werden
 können,
- 25 R¹⁸ außerdem für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder
 verschieden substituiertes C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-
 C₄-alkyl, Aryl, Aryl-C₁-C₄-alkyl, Heteroaryl oder Heteroaryl-C₁-C₄-
 alkyl, welche jeweils 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benach-
 barte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefel-
 atome enthalten steht, wobei die Substituenten zusätzlich zu den oben
 genannten aus Nitro und C₁-C₆-Alkoxycarbonyl ausgewählt werden
 können,
- 30 R¹⁸ außerdem für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder
 verschieden substituiertes C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-
 C₄-alkyl, Aryl, Aryl-C₁-C₄-alkyl, Heteroaryl oder Heteroaryl-C₁-C₄-
 alkyl, welche jeweils 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benach-
 barte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefel-
 atome enthalten steht, wobei die Substituenten zusätzlich zu den oben
 genannten aus Nitro und C₁-C₆-Alkoxycarbonyl ausgewählt werden
 können,

5

R^{17} und R^{18} außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen 5- oder 6-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus, der 1 oder 2 weitere Heteroatome enthalten kann, welche 0 bis 2 Stickstoffatome, 0 oder 1 Sauerstoffatom und/oder 0 oder 1 Schwefelatom sein können, und der gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch C_1 - C_4 -Alkyl substituiert sein kann, stehen,

10

O für eine der folgenden Gruppierungen



15

steht, wobei die Reste R¹¹ die gleiche oder verschiedene Bedeutungen haben können, wenn sie mehrfach in derselben heterocyclischen Gruppierung vorkommen steht,

5 m für 0, 1, 2 oder 3 steht, wobei die Wiederholungseinheit -(CHR¹⁴)- innerhalb der Seitenkette einer heterocyclischen Gruppierung die gleiche oder verschiedene Bedeutungen haben kann, wenn m für 2 oder 3 steht,

10 G für Sauerstoff oder Schwefel steht,

R¹⁹ und R²⁰ unabhängig voneinander für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder gemeinsam für C₂-C₃-Alkylen stehen,

15 R²¹ für Wasserstoff, für gegebenenfalls einfach oder zweifach, gleich oder verschieden durch C₁-C₄-Alkylcarbonyloxy oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes C₁-C₄-Alkyl; oder für gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkylcarbonyl, C₁-C₈-Alkoxycarbonyl, C₃-C₅-Alkylen substituiertes Aryl steht,

R²² für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl steht,

25 R²³ für Wasserstoff, Amino, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl steht.

6. Pyridylpyrimidine der Formel (I) gemäß Anspruch 5, in welcher

30 R¹⁶ für Wasserstoff; für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor-

und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl, C₂-C₄-Alkenyloxycarbonyl, C₁-C₄-Alkylcarbonyloxy, C₂-C₄-Alkenylcarbonyloxy, Oxy(C₁-C₄-alkylen)oxy, Oxetanyl, Dioxanyl, Oxazolidinyl, Dioxolanyl, Aryloxy, Halogenaryloxy, -CONR⁴R⁵, -NR⁴R⁵, -ONR⁴R⁵, -C(R¹⁴)=N-OR¹⁴ substituiertes C₁-C₆-Alkyl, Decyl, Dodecyl, Tetradecyl, Hexadecyl, C₂-C₆-Alkenyl, Decenyl, C₂-C₄-Alkinyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl, C₁-C₄-Alkylcarbonyloxy substituiertes Aryl, Aryl-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, 4- bis 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes, Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C₁-C₄-alkyl, welche jeweils 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten; oder für einen der Reste Q steht,

R¹⁸ für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, C₁-C₄-Alkyl, C₂-C₄-Alkenyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Hydroxy, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, Oxy(C₁-C₄-alkylen)oxy substituiertes C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, Aryl, Aryl-C₁-C₄-alkyl, Heteroaryl oder Heteroaryl-C₁-C₄-alkyl, welche jeweils 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten; oder für -S(O)_pR³, -OR¹⁴ oder -NR⁴R⁵ steht.

7. Pyridylpyrimidine der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher

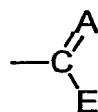
R¹ und R² unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom,
5 Nitro, Cyano, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-
Butyl, t-Butyl, -CF₃, -CCl₃, -CHF₂, -CClF₂, -CHCl₂, -CF₂CHFCI,
-CF₂CH₂F, -CF₂CCl₃, -CH₂CF₃, -CF₂CHFCF₃, -CH₂CF₂H,
-CH₂CF₂CF₃, -CF₂CF₂H, -CF₂CHFCF₃, Methoxy, Ethoxy, n-Prop-
oxy, i-Propoxy, n-Butoxy, Trifluormethoxy, Trichlormethoxy,
10 -OCH₂CF₃, -SCF₃, -SCHF₂, -SO₂Me, -SO₂CHF₂, -SO₂CF₃,
-SOCHF₂, -SOCF₃, -COMe, -CO₂Me, -CO₂Et, Amino, Cyclopentyl,
Cyclohexyl; jeweils gegebenenfalls durch Chlor, Brom, Methyl, Ethyl,
Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl, Trifluormethoxy substituiertes
Phenyl, Benzyl, Pyridinyl, Furyl, Furfuryl stehen,

15 R¹ und R² außerdem gemeinsam für Propylen, Butylen, Propenylen oder
Butadienylen, -(CH₂)₂-O-CH₂-, -(CH₂)₂-NH-CH₂-, -CH=CH-N=CH-,
-CH=CCl-CH=CH- stehen,

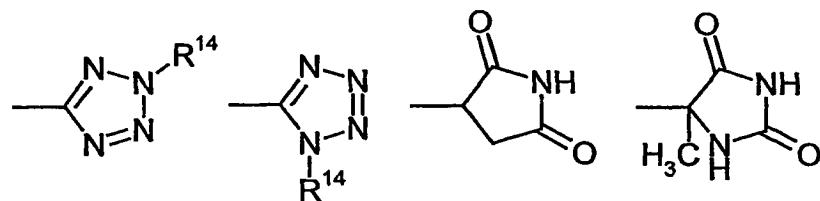
X für Fluor, Chlor, Brom, Nitro, Cyano, Hydroxy, Methyl, Ethyl, n-
20 Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, -CF₃, -CCl₃,
-CHF₂, -CClF₂, -CHCl₂, -CF₂CHFCI, -CF₂CH₂F, -CF₂CCl₃,
-CH₂CF₃, -CF₂CHFCF₃, -CH₂CF₂H, -CH₂CF₂CF₃, -CF₂CF₂H,
-CF₂CHFCF₃, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, i-Propoxy, n-Butoxy,
Trifluormethoxy, Trichlormethoxy, -OCH₂CF₃, -SCF₃, -SCHF₂,
-SO₂Me, -SO₂CHF₂, -SO₂CF₃, -SOCHF₂, -SOCF₃, -CH=CH₂,
25 -C≡CH, Amino, -NHMe, -NMe₂, -CHO, -COMe, -CO₂Me, -CO₂Et,
-NHCOMe, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Phenyl, Benzyl, Furyl, Thienyl,
Pyrrolyl, Oxazolyl, Isoxazyl, Imidazyl, Pyrazyl, Thiazolyl, Pyridyl,
Pyrimidinyl, Pyridazyl, Triazinyl, Triazyl; oder wenn n für 2 steht,
30 stehen zwei benachbarte Reste X außerdem gemeinsam für Propylen,
Butylen, Propenylen oder Butadienylen, -(CH₂)₂-O-CH₂-,
-(CH₂)₂-NH-CH₂-, -CH=CH-N=CH- steht,

- 214 -

- X außerdem für Methylthio, Ethylthio, n-Propylthio, i-Propylthio steht,
- n für 0, 1 oder 2 steht, wobei X für gleiche oder verschiedene Reste steht, wenn n für 2 steht,
- 5 Y für eine direkte Bindung, Sauerstoff, -S(O)_p- oder -NR⁹- steht,
- p für 0, 1 oder 2 steht,
- 10 Z für -CH₂-, -(CH₂)₂-, -(CH₂)₃-, -(CH₂)₄-, -(CHR¹⁰)-, -CH₂-C(O)-CH₂-, -CH₂-NH-, -CH=CH-, -CH₂-CH=CH-, -CH=C(OH)-, -CH=C(OMe)-, -CH₂-C(OMe)=CH- steht,
- Z außerdem für -CH₂-C(OEt)=CH- steht,
- 15 R für die Gruppierung



oder für ein Carbonsäurebioisoster (Säuremimic), insbesondere aus der Gruppe



steht,

- 25 A für Sauerstoff oder Schwefel steht,
- E für -OR¹⁶, -SR¹⁶, -O-M oder -NR¹⁷R¹⁸ steht,

- M für Tetrabutylammonium, Trimethylbenzylammonium oder für ein Natriumkation (Na^+) oder ein Kaliumkation (K^+) steht,
- 5 M außerdem für ein Magnesiumkation (Mg^{2+}) oder ein Calciumkation (Ca^{2+}) steht, wobei jeweils zwei Moleküle einer Verbindung ein Salz mit einem solchen Ion bilden,
- 10 R⁴ für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, -COMe steht,
- R⁵ für Wasserstoff, Amino, Formyl, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, Vinyl, Propargyl, Methoxy, Methoxymethyl, -COMe, -COEt, t-Butoxycarbonyl, Oxamoyl steht,
- 15 R⁴ und R⁵ außerdem gemeinsam für Ethylen, i-Propylen, s-Butylen, Nitrobenzyliden stehen,
- 20 R⁴ und R⁵ außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen 5- oder 6-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus aus der Reihe Morphin, Piperidin, Thiomorpholin, Pyrrolidin, Tetrahydropyridin, der gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl substituiert sein kann, stehen,
- 25 R⁸ für Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, -CF₃, -CCl₃, -CHF₂, -CClF₂, -CHCl₂, -CF₂CHFCI, -CF₂CH₂F, -CF₂CCl₃, -CH₂CF₃, -CF₂CHFCF₃, -CH₂CF₂H, -CH₂CF₂CF₃, -CF₂CF₂H oder für -CF₂CHFCF₃ steht,
- 30 R⁹ für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, -CH₂CF₃, -CH₂CF₂H, -CH₂CF₂CF₃, Cyclopropyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl steht,

- 5 R¹⁰ für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, -COMe, -COEt, -CO₂Me, -CO₂Et, Cyclohexyl; Phenyl oder Benzyl, welche ihrerseits im Arylteil einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom oder Methyl substituiert sein können steht,
- 10 R¹¹ für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl steht,
- 15 R¹⁴ für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl oder t-Butyl steht,
- 20 R¹⁵ für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl oder Cyano steht,
- 25 R¹⁶ für Wasserstoff; für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, Methoxy, Ethoxy, i-Propoxy, Trifluormethoxy, -OCH₂CF₃, Trichlormethoxy, Difluormethoxy, Methylthio, Trifluormethylthio, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, i-Propoxycarbonyl, t-Butoxycarbonyl, Methylcarbonyloxy, Vinylcarbonyloxy, -O-(CH₂)₂-O-, Oxetanyl, Dioxanyl, Oxazolidinyl, Dioxolanyl, Phenoxy, Fluorphenoxy, -CONR⁴R⁵, -NR⁴R⁵, -ONR⁴R⁵, -CH=N-OCH₃ substituiertes Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, n-Pentyl, Isopentyl, Siamyl, Hexyl, n-Decyl, n-Dodecyl, n-Tetradecyl, n-Hexadecyl, Vinyl, Allyl, Butenyl, 2-Isopentenyl, Hexenyl, n-Decenyl, Ethinyl, Propinyl, Butinyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, -CF₃, -CCl₃, -CHF₂, -CClF₂, -CHCl₂, -CF₂CHFCl, -CF₂CH₂F, -CF₂CCl₃, -CH₂CF₃, -CF₂CHFCF₃, -CH₂CF₂H, -CH₂CF₂CF₃, -CF₂CF₂H, -CF₂CHFCF₃, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, n-Butoxy, Trifluor-
- 30

- methoxy, Trichlormethoxy, Methylthio, Trifluormethylthio, -CO₂Me,
-CO₂Et, Methylcarbonyloxy, Ethylcarbonyloxy substituiertes Phenyl,
Benzyl, Phenylethyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclo-
hexyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl,
Cyclohexylmethyl, Cyclopropylethyl, Cyclobutylethyl, Cyclopentyl-
ethyl, Cyclohexylethyl, Oxetanyl, Oxazolanyl, Dioxanyl, Dioxolanyl,
Furyl, Thienyl, Pyrrolyl, Oxazolyl, Isoxazyl, Imidazolyl, Pyrazyl,
Thiazolyl, Pyridinyl, Pyrimidinyl, Pyridazyl, Triazinyl, Triazolyl,
Tetrahydropyranyl, Thietanyl, Thietandioxid, Oxetanylmethyl, Oxazo-
lanylmethyl, Dioxanylmethyl, Dioxolanylmethyl, Furylmethyl,
Thienylmethyl, Pyrrolylmethyl, Oxazolylmethyl, Isoxazylmethyl,
Imidazolylmethyl, Pyrazylmethyl, Thiazolylmethyl, Pyridinylmethyl,
Pyrimidinylmethyl, Pyridazylmethyl, Triazinylmethyl, Triazolyl-
methyl, Tetrahydropyranylmethyl, Thietanylmethyl, Thietandioxid-
methyl, Oxetanylethyl, Oxazolanylethyl, Dioxanylethyl, Dioxolanyl-
ethyl, Furylethyl, Thienylethyl, Pyrrolylethyl, Oxazolyethyl,
Isoxazolethyl, Imidazolyethyl, Pyrazylethyl, Thiazolyethyl,
Pyridinylethyl, Pyrimidinylethyl, Pyridazylethyl, Triazinylethyl,
Triazolylethyl, Tetrahydropyranylethyl, Thietanylethyl, Thietandioxid-
ethyl; oder für einen der Reste Q steht,
- R¹⁶ außerdem für jeweils gegebenenfalls bis zur maximal möglichen Zahl,
gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor und/oder Brom substi-
tuiertes Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl,
t-Butyl, n-Pentyl, Isopentyl, Siamyl, Hexyl, n-Decyl, n-Dodecyl, n-
Tetradecyl, n-Hexadecyl, Vinyl, Allyl, Butenyl, 2-Isopentenyl,
Hexenyl, n-Decenyl, Ethinyl, Propinyl, Butinyl steht,
- R¹⁶ außerdem für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder
verschieden substituiertes Phenyl, Benzyl, Phenylethyl, Cyclopropyl,
Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutyl-
methyl, Cyclopentylmethyl, Cyclohexylmethyl, Cyclopropylethyl,

Cyclobutylethyl, Cyclopentylethyl, Cyclohexylethyl, Oxetanyl,
Oxazolanyl, Dioxanyl, Dioxolanyl, Furyl, Thienyl, Pyrrolyl, Oxazolyl,
Isoxazyl, Imidazolyl, Pyrazyl, Thiazolyl, Pyridinyl, Pyrimidinyl,
Pyridazyl, Triazinyl, Triazolyl, Tetrahydropyranyl, Thietanyl, Thietan-
dioxid, Oxetanylmethyl, Oxazolanylmethyl, Dioxanylmethyl, Dioxola-
nylmethyl, Furylethyl, Thienylethyl, Pyrrolylmethyl, Oxazolyl-
methyl, Isoxazylmethyl, Imidazolylmethyl, Pyrazylmethyl, Thiazolyl-
methyl, Pyridinylmethyl, Pyrimidinylmethyl, Pyridazylmethyl,
Triazinylmethyl, Triazolylmethyl, Tetrahydropyranylmethyl, Thietan-
ylmethyl, Thietandioxidmethyl, Oxetanylethyl, Oxazolanylethyl,
Dioxanylethyl, Dioxolanylethyl, Furylethyl, Thienylethyl, Pyrrolyl-
ethyl, Oxazolylethyl, Isoxazylethyl, Imidazolylethyl, Pyrazylethyl,
Thiazolylethyl, Pyridinylethyl, Pyrimidinylethyl, Pyridazylethyl,
Triazinylethyl, Triazolylethyl, Tetrahydropyranylethyl, Thietanylethyl,
Thietandioxidethyl steht, wobei die Substituenten zusätzlich zu den
oben genannten aus Hydroxy und Nitro ausgewählt werden können,

- R¹⁷ für Wasserstoff, Methyl oder Ethyl steht,
- R¹⁸ für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl,
n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, Vinyl, Allyl; oder für jeweils
gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch
Fluor, Chlor, Hydroxy, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl,
s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Methoxy,
Ethoxy, Trifluormethoxy, Methylthio, Trifluormethylthio, -O-CH₂-O-
substituiertes Cyclopropyl, Cyclopropylmethyl, Cyclohexyl, Phenyl,
Benzyl, Phenylethyl, Pyridinyl, Pyridinylmethyl, Pyridinylethyl, Furyl,
Furfuryl; oder für -SO₂Me, -SO₂Et oder -NR⁴R⁵ steht,
- R¹⁸ außerdem für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder
verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Amino, Hydroxy, Cyano,
Nitro, Methoxy, Ethoxy, i-Propoxy, Trifluormethoxy, -OCH₂CF₃,

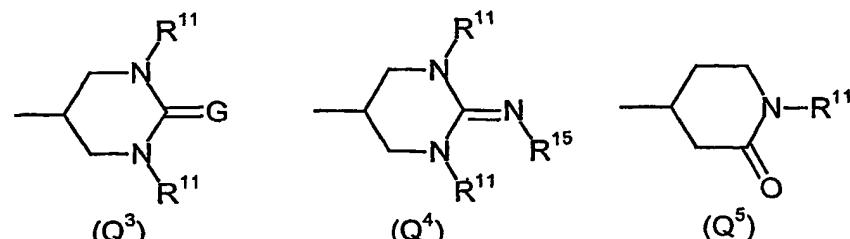
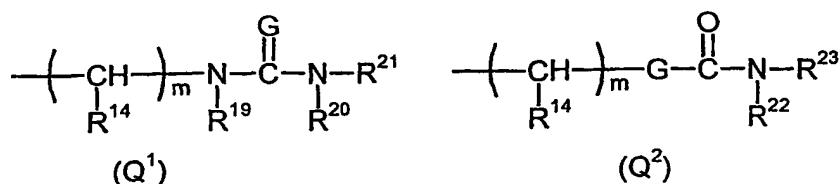
5 Trichlormethoxy, Difluormethoxy, Methylthio, Trifluormethylthio, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, i-Propoxycarbonyl, t-Butoxycarbonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, Vinyl, Allyl; oder für jeweils gegebenenfalls bis zur maximal möglichen Zahl, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor und/oder Brom substituiertes Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, Vinyl, Allyl steht,

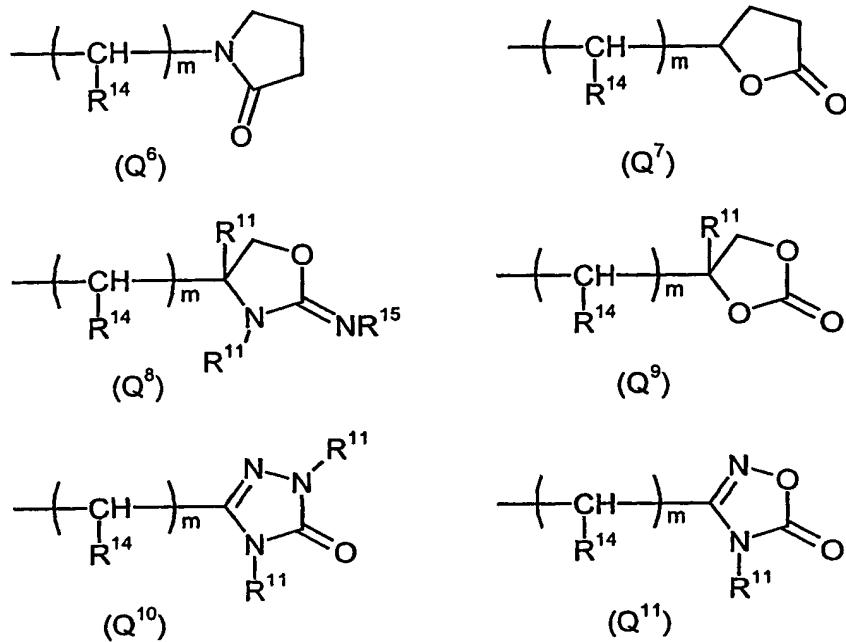
10 R¹⁸ außerdem für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden substituiertes Cyclopropyl, Cyclopropylmethyl, Cyclohexyl, Phenyl, Benzyl, Phenylethyl, Pyridinyl, Pyridinylmethyl, Pyridinylethyl, Furyl, Furfuryl steht, wobei die Substituenten zusätzlich zu den oben genannten aus Nitro, Methoxycarbonyl und Ethoxycarbonyl ausgewählt werden können,

15 R¹⁷ und R¹⁸ außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen 5- oder 6-gliedrigen gesättigten Heterocyclus aus der Reihe Piperazin, Morpholin, Piperidin, Pyrrolidin, welcher gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Methyl, Ethyl, n-Propyl oder i-Propyl substituiert sein kann, steht,

20

Q für eine der folgenden Gruppierungen





5 steht, wobei die Reste R¹¹ die gleiche oder verschiedene Bedeutungen haben können, wenn sie mehrfach in derselben heterocyclischen Gruppierung vorkommen steht,

10 m für 0, 1, 2 oder 3 steht, wobei die Wiederholungseinheit -(CHR¹⁴)- innerhalb der Seitenkette einer heterocyclischen Gruppierung die gleiche oder verschiedene Bedeutungen haben kann, wenn m für 2 oder 3 steht,

G für Sauerstoff oder Schwefel steht,

15 R¹⁹ und R²⁰ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, oder gemeinsam für -(CH₂)₂- oder -(CH₂)₃- steht,

20 R²¹ für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls einfach durch t-Butyl-carbonyloxy oder Methoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach oder zweifach, gleich oder verschieden durch Chlor,

Cyano, Methyl, Ethyl, t-Butyl, Trifluormethyl, s-Butyloxycarbonyl, t-Butyloxycarbonyl, n-Octyloxycarbonyl, -(CH₂)₄- substituiertes Phenyl steht,

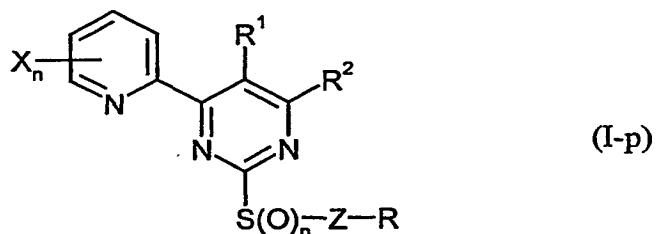
- 5 R²² für Wasserstoff, Methyl, Ethyl oder Methoxymethyl steht,
- 10 R²³ für Wasserstoff, Amino, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl oder Methoxymethyl steht.
- 15 8. Pyridylpyrimidine der Formel (I) gemäß Anspruch 7, in welcher X für Fluor, Chlor, Brom, Nitro, Cyano, Hydroxy, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, -CF₃, -CCl₃, -CHF₂, -CClF₂, -CHCl₂, -CF₂CHFCl, -CF₂CH₂F, -CF₂CCl₃, -CH₂CF₃, -CF₂CHFCF₃, -CH₂CF₂H, -CH₂CF₂CF₃, -CF₂CF₂H, -CF₂CHFCF₃, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, i-Propoxy, n-Butoxy, Trifluormethoxy, Trichlormethoxy, -OCH₂CF₃, -SCF₃, -SCHF₂, -SO₂Me, -SO₂CHF₂, -SO₂CF₃, -SOCHF₂, -SOCF₃, -CH=CH₂, -C≡CH, Amino, -NHMe, -NMe₂, -CHO, -COMe, -CO₂Me, -CO₂Et, -NHCOMe, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Phenyl, Benzyl, Furyl, Thienyl, Pyrrolyl, Oxazolyl, Isoxazyl, Imidazyl, Pyrazyl, Thiazolyl, Pyridyl, Pyrimidinyl, Pyridazyl, Triazinyl, Triazyl; oder wenn n für 2 steht, stehen zwei benachbarte Reste X außerdem gemeinsam für Propylen, Butylen, Propenylen oder Butadienylen, -(CH₂)₂-O-CH₂-, -(CH₂)₂-NH-CH₂-, -CH=CH-N=CH- steht,
- 20 Z für -CH₂-, -(CH₂)₂-, -(CH₂)₃-, -(CH₂)₄-, -(CHR¹⁰)-, -CH₂-C(O)-CH₂-, -CH₂-NH-, -CH=CH-, -CH₂-CH=CH-, -CH=C(OH)-, -CH=C(OMe)-, -CH₂-C(OMe)=CH- steht,
- 25 R¹⁶ für Wasserstoff; für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Amino, Hydroxy, Cyano,
- 30

Nitro, Methoxy, Ethoxy, i-Propoxy, Trifluormethoxy, -OCH₂CF₃,
Trichlormethoxy, Difluormethoxy, Methylthio, Trifluormethylthio,
Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, i-Propoxycarbonyl, t-Butoxycarb-
onyl, Methylcarbonyloxy, Vinylcarbonyloxy, -O-(CH₂)₂-O-, Oxetanyl,
5 Dioxanyl, Oxazolidinyl, Dioxolanyl, Phenoxy, Fluorphenoxy,
-CONR⁴R⁵, -NR⁴R⁵, -ONR⁴R⁵, -CH=N-OCH₃ substituiertes Methyl,
Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, n-Pentyl,
Isopentyl, Siamyl, Hexyl, n-Decyl, n-Dodecyl, n-Tetradecyl, n-
10 Hexadecyl, Vinyl, Allyl, Butenyl, 2-Isopentenyl, Hexenyl, n-Decenyl,
Ethinyl, Propinyl, Butinyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis
dreifach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl,
Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, -CF₃,
-CCl₃, -CHF₂, -CClF₂, -CHCl₂, -CF₂CHFCI, -CF₂CH₂F, -CF₂CCl₃,
-CH₂CF₃, -CF₂CHFCF₃, -CH₂CF₂H, -CH₂CF₂CF₃, -CF₂CF₂H,
15 -CF₂CHFCF₃, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, n-Butoxy, Trifluor-
methoxy, Trichlormethoxy, Methylthio, Trifluormethylthio, -CO₂Me,
-CO₂Et, Methylcarbonyloxy, Ethylcarbonyloxy substituiertes Phenyl,
Benzyl, Phenylethyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclo-
hexyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl,
20 Cyclohexylmethyl, Cyclopropylethyl, Cyclobutylethyl, Cyclopentyl-
ethyl, Cyclohexylethyl, Oxetanyl, Oxazolanyl, Dioxanyl, Dioxolanyl,
Furyl, Thienyl, Pyrrolyl, Oxazolyl, Isoxazyl, Imidazolyl, Pyrazyl,
Thiazolyl, Pyridinyl, Pyrimidinyl, Pyridazyl, Triazinyl, Triazolyl,
Tetrahydropyranyl, Thietanyl, Thietandioxid, Oxetanylmethyl, Oxazo-
25 lanylmethyl, Dioxanylmethyl, Dioxolanylmethyl, Furylmethyl,
Thienylmethyl, Pyrrolylmethyl, Oxazolylmethyl, Isoxazylmethyl,
Imidazolylmethyl, Pyrazylmethyl, Thiazolylmethyl, Pyridinylmethyl,
Pyrimidinylmethyl, Pyridazylmethyl, Triazinylmethyl, Triazolyl-
methyl, Tetrahydropyranylmethyl, Thietanylmethyl, Thietandioxid-
30 methyl, Oxetanylethyl, Oxazolanylethyl, Dioxanylethyl, Dioxolany-
ethyl, Furylethyl, Thienylethyl, Pyrrolylethyl, Oxazolylethyl,
Isoxazylethyl, Imidazolylethyl, Pyrazylethyl, Thiazolylethyl,

Pyridinylethyl, Pyrimidinylethyl, Pyridazylethyl, Triazinylethyl, Triazolylethyl, Tetrahydropyranylethyl, Thietanylethyl, Thietandioxidethyl; oder für einen der Reste Q steht,

- 5 R¹⁸ für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, Vinyl, Allyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Hydroxy, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethoxy, Methylthio, Trifluormethylthio, -O-CH₂-O-substituiertes Cyclopropyl, Cyclopropylmethyl, Cyclohexyl, Phenyl, Benzyl, Phenylethyl, Pyridinyl, Pyridinylmethyl, Pyridinylethyl, Furyl, Furfuryl; oder für -SO₂Me, -SO₂Et oder -NR⁴R⁵ steht.
- 10

15 9. Pyridylpyrimidine der Formel (I-p)

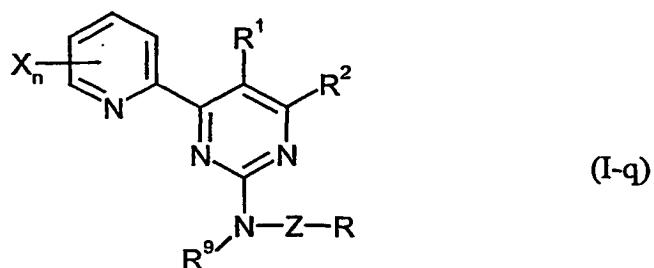


in welcher

R¹, R², X, n, p, Z und R die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

20

10. Pyridylpyrimidine der Formel (I-q)

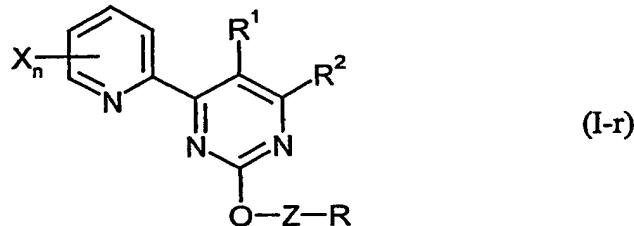


in welcher

- 224 -

R¹, R², X, n, Z, R und R⁹ die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

11. Pyridylpyrimidine der Formel (I-r)

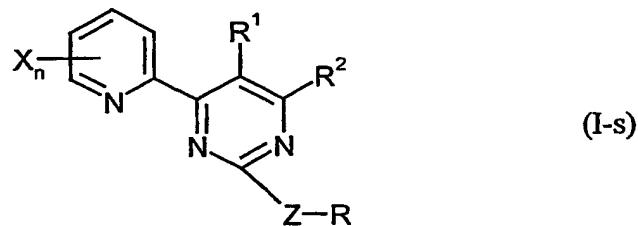


5

in welcher

R¹, R², X, n, Z und R die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

10 12. Pyridylpyrimidine der Formel (I-s)

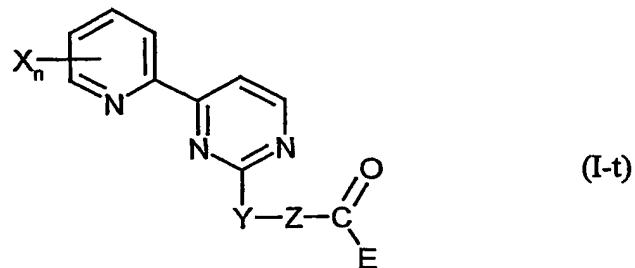


in welcher

R¹, R², X, n, Z und R die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

15

13. Pyridylpyrimidine der Formel (I-t)



in welcher

X für Methyl, Ethyl, Chlor, Brom, -CF₃, Methoxy oder Trifluormethoxy steht,

n für 0, 1 oder 2 steht, wobei X für gleiche oder verschiedene Reste steht, wenn n für 2 steht,
5

Y für -S- oder -NR⁹- steht,

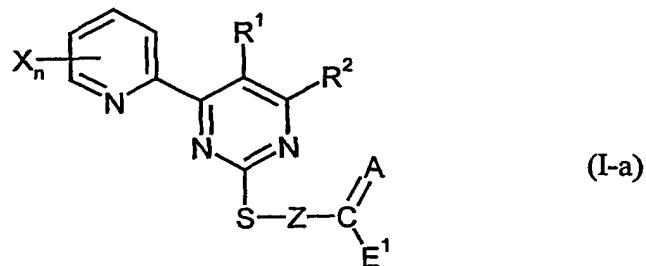
Z für -CH₂- oder -(CH₂)₂- steht,

10 E für Hydroxy, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, i-Propoxy, n-Butoxy, i-Butoxy, s-Butoxy, t-Butoxy, -NH-SO₂Me oder -NH-SO₂Et steht,

R⁹ für Wasserstoff, Methyl oder Ethyl steht.

15 14. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet,

dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-a)



20 in welcher

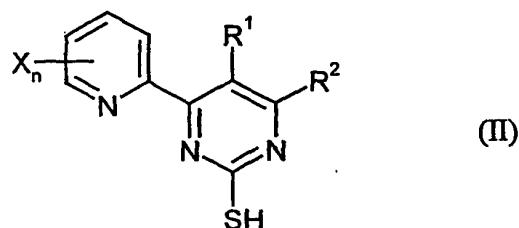
R¹, R², X, n, Z und A die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben und

25 E¹ für -OR¹⁶, -SR¹⁶ oder -NR¹⁷R¹⁸ steht,

- 226 -

erhält, indem man

A) Thiole der Formel (II)

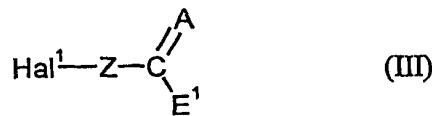


5

in welcher

R¹, R², X und n die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

10 mit Halogen-Verbindungen der Formel (III)



in welcher

15 Z und A die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

E¹ die oben angegebenen Bedeutungen hat,

Hal¹ für Halogen steht,

20

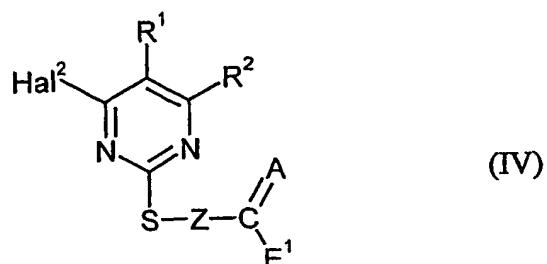
gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels umsetzt,

oder

25

- 227 -

B) Halogenpyrimidine der Formel (IV)



in welcher

5

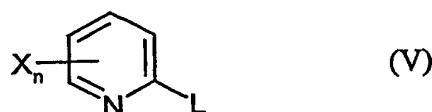
R^1 , R^2 , Z und A die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

E^1 die oben angegebenen Bedeutungen hat,

10

Hal^2 für Halogen steht,

mit Pyridin-Verbindungen der Formel (V)



15

in welcher

X und n die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben und

L für $Sn(Alkyl)_3$, $Sn(Aryl)_3$, $ZnBr$ oder $ZnCl$ steht,

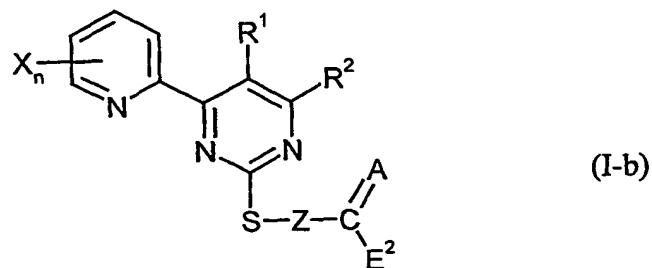
20

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und in Ge-
genwart eines Katalysators umsetzt,

oder

25

C) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-b)



in welcher

5

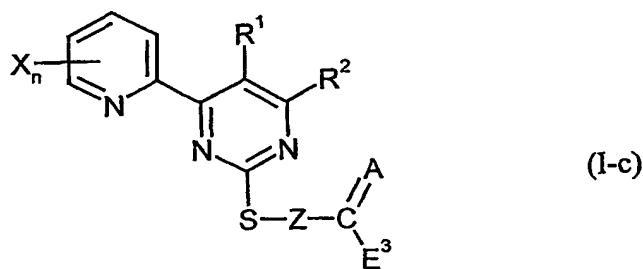
R^1 , R^2 , X , n , Z und A die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben und

E^2 für $-NR^{17}R^{18}$ steht,

10

erhält, indem man

Pyridylpyrimidine der Formel (I-c)



15

in welcher

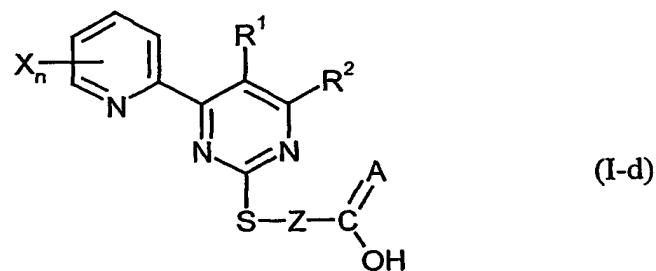
R^1 , R^2 , X , n , Z und A die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben und

20

E^3 für $-OR^{16}$ steht, wobei R^{16} die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen hat,

in einer ersten Stufe gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels mit einer Base behandelt und die entstandene Verbindung der Formel (I-d)

5

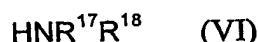


in welcher

R¹, R², X, n, Z und A die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

10

in einer zweiten Stufe mit Aminen der Formel (VI)



15

in welcher

R¹⁷ und R¹⁸ die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

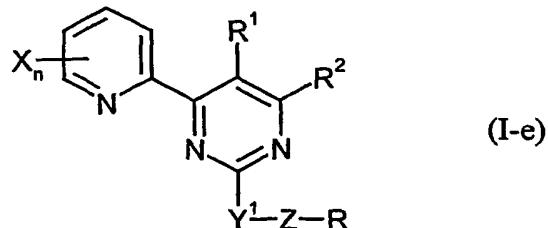
20

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und in Gegenwart eines wasserabsorbierenden Reagenzes umsetzt,

oder

- 230 -

D) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-e)



in welcher

5

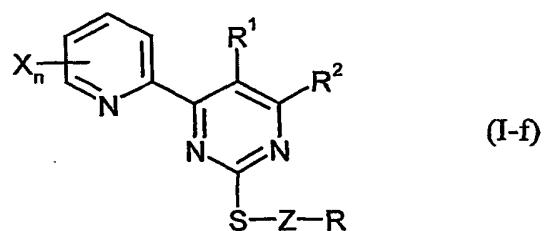
R^1 , R^2 , X , n , Z und R die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben und

Y^1 für $-SO-$ oder $-SO_2-$ steht,

10

erhält, indem man

Pyridylpyrimidine der Formel (I-f)



15

in welcher

R^1 , R^2 , X , n , Z und R die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

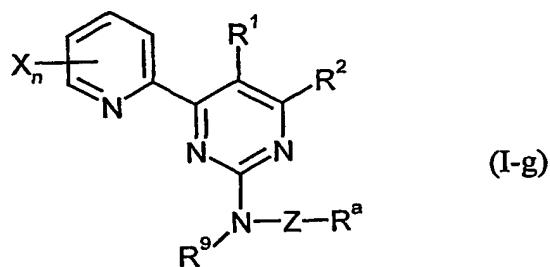
20.

mit einem Oxidationsmittel gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators oxidiert,

- 231 -

oder

E) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-g)



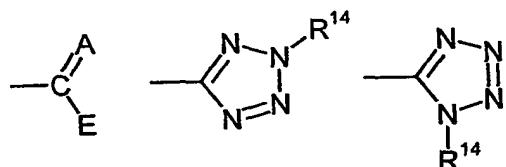
5

in welcher

R¹, R², X, n, Z und R⁹ die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben und

10

R^a für eine der folgenden Gruppierungen steht



in welcher

15

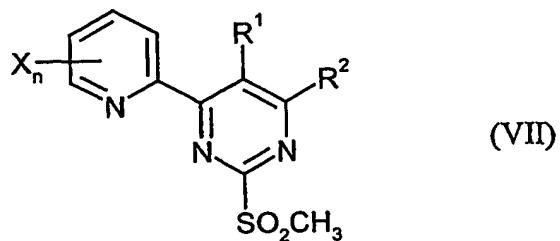
R¹⁴ die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen hat,

erhält, indem man

20

Methylsulfonylpyrimidine der Formel (VII)

- 232 -



in welcher

R^1 , R^2 , X und n die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

5

mit Aminen der Formel (VIII)



in welcher

10

Z und R^9 die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

R^a die oben angegebenen Bedeutungen hat,

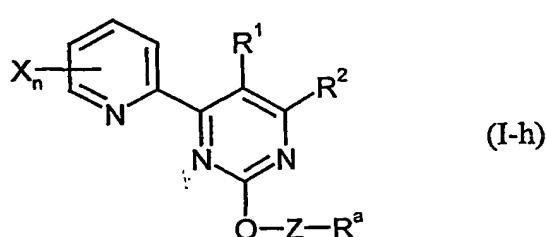
15

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart einer Base umsetzt,

oder

20

F) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-h)



- 233 -

in welcher

R¹, R², X, n und Z die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

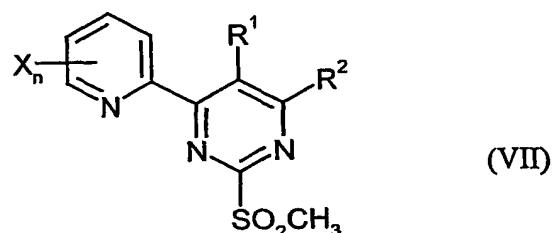
5

R^a die oben angegebenen Bedeutungen hat,

erhält, indem man

10

Methylsulfonylpyrimidine der Formel (VII)



in welcher

15

R¹, R², X und n die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

mit Hydroxy-Verbindungen der Formel (IX)



20

in welcher

Z die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen hat,

R^a die oben angegebenen Bedeutungen hat,

25

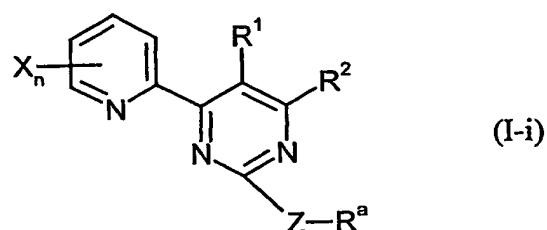
gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart einer Base umsetzt,

- 234 -

oder

G) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-i)

5



in welcher

R¹, R², X, n und Z die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen

10

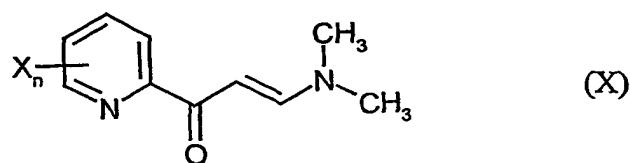
haben,

R^a die oben angegebenen Bedeutungen hat,

erhält, indem man

15

Pyridin-Derivate der Formel (X)



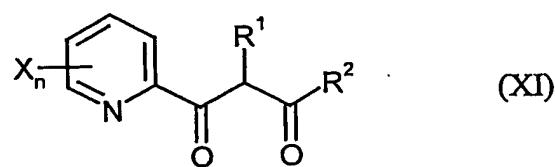
in welcher

20

X und n die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

oder Pyridin-Derivate der Formel (XI)

- 235 -



in welcher

R¹, R², X und n die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

5

mit Amidinen der Formel (XII)



in welcher

10

Z die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen hat,

15

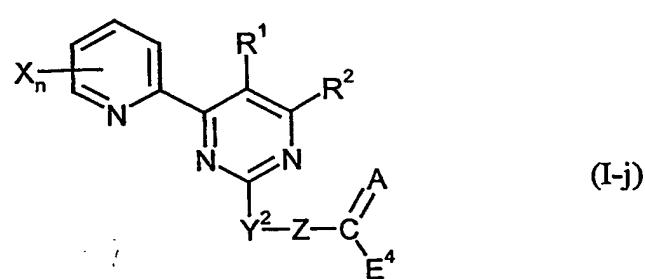
R^a die oben angegebenen Bedeutungen hat,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart einer Base umsetzt,

oder

20

H) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-j)



in welcher

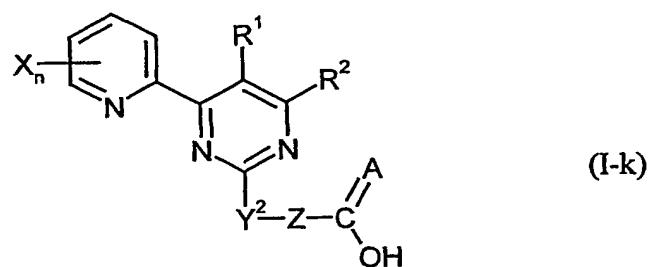
- 236 -

Y² für eine direkte Bindung, Sauerstoff, Schwefel oder -NR⁹- steht,

5 E⁴ für -O-M oder -S-M steht und R¹, R², X, n, Z, A und M die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

erhält, indem man

10 Pyridylpyrimidine der Formel (I-k)



in welcher

15 R¹, R², X, n, Z und A die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

Y² die oben angegebenen Bedeutungen hat,

20 mit Hydroxiden der Formel (XIII)

M OH⁻ (XIII)

in welcher

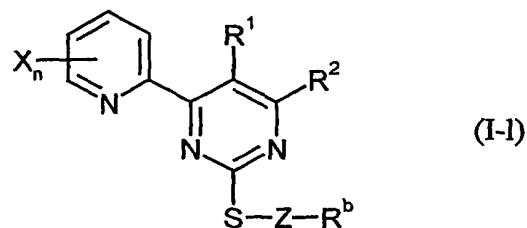
25 M die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen hat,

- 237 -

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

oder

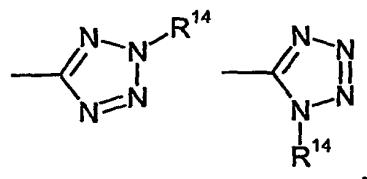
5 J) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-I)



in welcher

10 R¹, R², X, n, Y und Z die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben und

R^b für eine der folgenden Gruppierungen steht



15 ,

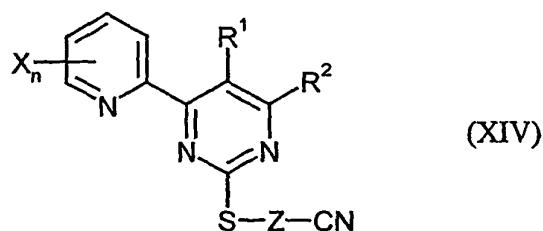
worin R¹⁴ die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen hat,

erhält, indem man

20

Nitrile der Formel (XIV)

- 238 -



in welcher

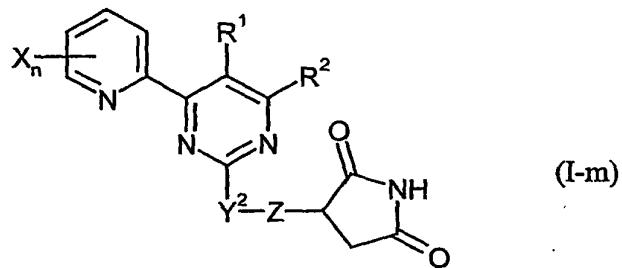
R¹, R², X, n und Z die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen

5 haben

mit Trialkylzinnaziden gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

10 oder

K) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-m)

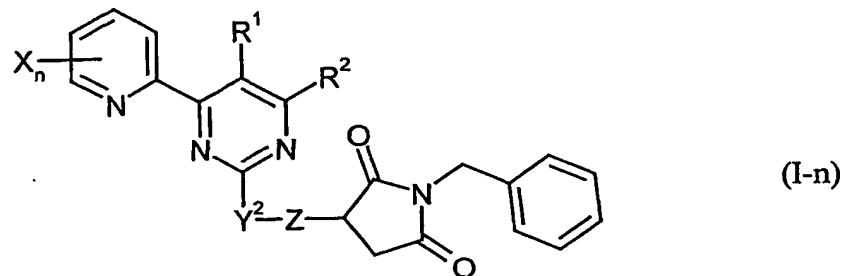


15 in welcher

R¹, R², X, n und Z die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,20 Y² die oben angegebenen Bedeutungen hat,

erhält, indem man

Pyridylpyrimidine der Formel (I-n)



in welcher

5

R^1 , R^2 , X , n und Z die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

Y^2 die oben angegebenen Bedeutungen hat,

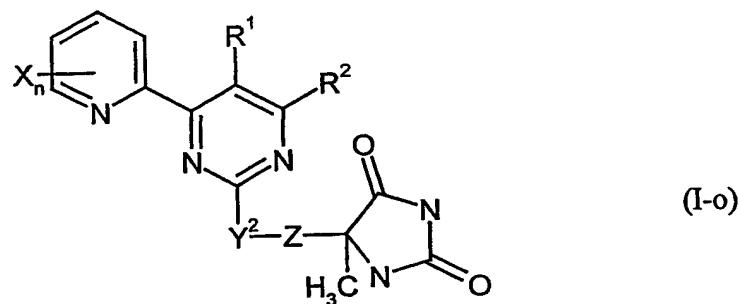
10

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und in Gegenwart eines Katalysators hydriert,

oder

15

L) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-o)



in welcher

20



- 240 -

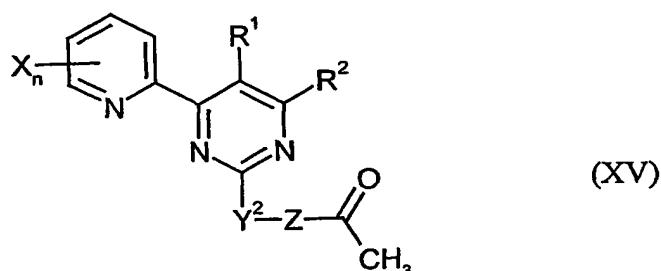
R¹, R², X, n und Z die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

Y² die oben angegebenen Bedeutungen hat,

5

erhält, indem man

Keto-Verbindungen der Formel (XV)



10

in welcher

R¹, R², X, n und Z die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

15

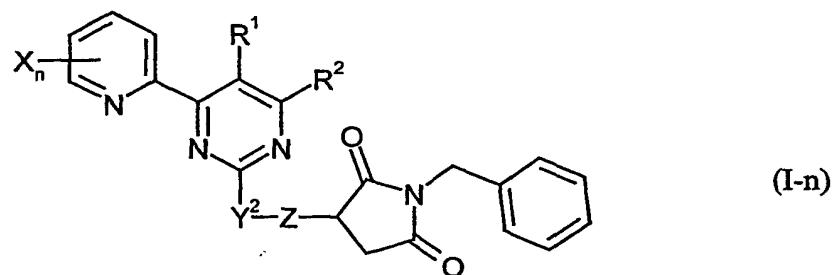
Y² die oben angegebenen Bedeutungen hat,

mit Ammoniumcarbonat und Kaliumcyanid gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt.

20

- 15. Schädlingsbekämpfungsmittel, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einer Verbindung der Formel (I) gemäß Anspruch 1 neben Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen.
- 25 16. Verwendung von Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1 zur Bekämpfung von Schädlingen.

17. Verfahren zur Bekämpfung von Schädlingen, dadurch gekennzeichnet, dass man Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1 auf Schädlinge und/oder ihren Lebensraum einwirken lässt.
- 5 18. Verfahren zur Herstellung von Schädlingsbekämpfungsmitteln, dadurch gekennzeichnet, dass man Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1 mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen vermischt.
- 10 19. Pyridylpyrimidine der Formel (I-n)

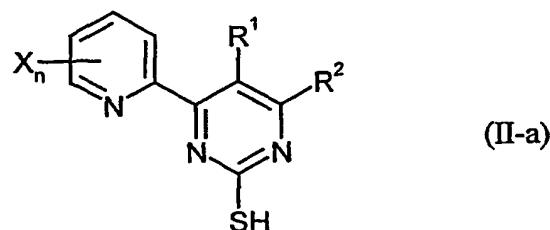


15 in welcher

Y^2 für eine direkte Bindung, Sauerstoff, Schwefel oder $-NR^9-$ steht,

15 R^1 , R^2 , X , n , Z und R^9 die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

20. Thiole der Formel (II-a)



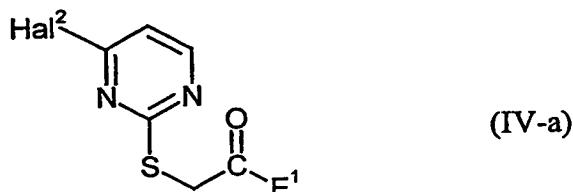
20

in welcher

- 242 -

R^1 , R^2 , X und n die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben, mit der Maßgabe, dass wenigstens einer der Reste R^1 , R^2 oder X nicht für Wasserstoff steht.

5 21. Halogenpyrimidine der Formel (IV-a)



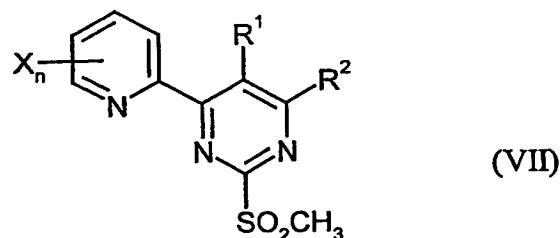
in welcher

- 10 a) E^1 für Methoxy oder Ethoxy steht und
 Hal^2 für Brom steht,

oder

- 15 b) E^1 für Methoxy steht und
 Hal^2 für Chlor steht.

22. Methylsulfonylpyrimidine der Formel (VII)



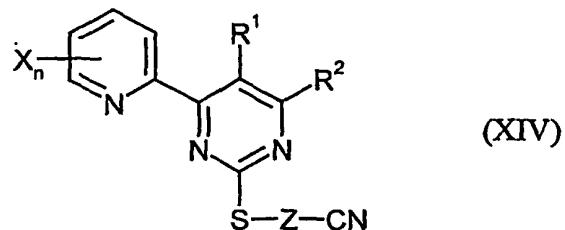
20

in welcher

R^1 , R^2 , X und n die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

- 243 -

23. Nitrile der Formel (XIV)

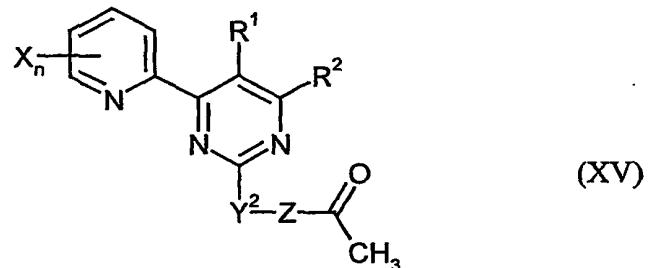


in welcher

5

 R^1, R^2, X, n und Z die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

24. Keto-Verbindungen der Formel (XV)



10

in welcher

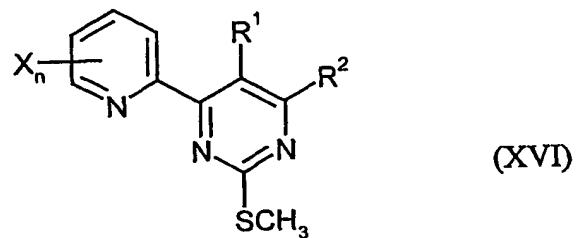
 Y^2 für eine direkte Bindung, Sauerstoff, Schwefel oder $-NR^9-$ steht,

15

 R^1, R^2, X, n, Z und R^9 die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

- 244 -

25. Methylthio-Derivate der Formel (XVI)



in welcher

5

R¹, R², X und n die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

PCT/EP 02/01403

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER			
IPC 7	A01N43/54	A01N43/647	A01N43/653
	A01N43/76	A01N43/78	A01N43/80
	C07D405/14	C07D409/14	C07D417/14

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
IPC 7 A01N C07D

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the International search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, WPI Data, PAJ, CHEM ABS Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category °	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 017, no. 532 (P-1619), 24 September 1993 (1993-09-24) & JP 05 143796 A (IKUO NAGATA), 11 June 1993 (1993-06-11) Zweite Verbindung in der linken Spalte page 877 ---	1-8, 12, 13
X	WO 00 61586 A (AKZO NOBEL NV ;ADANG ANTON EGBERT PETER (NL); GERRITSMA GERRILDINA) 19 October 2000 (2000-10-19) example 16 --- -/-	1-8, 12, 13

 Further documents are listed in the continuation of box C. Patent family members are listed in annex.

° Special categories of cited documents :

- "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- "E" earlier document but published on or after the international filing date
- "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

2 May 2002

Date of mailing of the international search report

08/05/2002

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Fritz, M

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category °	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	SAR ET AL.: "Synthesis, Oxidation and Claisen Rearrangement of 4-(Allyloxy)phenyl-1,4-dihdropyridines and -pyrimidines" ACH MODELS CHEM., vol. 131, no. 3-4, 1994, pages 363-376, XP001070105 Verbindung 11h page 366 ----	25
X	CORONA DEL L ET AL: "SYNTHESIS AND IN VITRO STUDY OF PLATELET ANTIAGGREGANT ACTIVITY OF 2(4)-IMIDAZOL-1-YL-4(2)-CYCLOALKYLAMINO PYRIMIDINES" EUROPEAN JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY, EDITIONS SCIENTIFIQUE ELSEVIER, PARIS, FR, vol. 26, 1991, pages 729-733, XP002064599 ISSN: 0223-5234 Erste Verbindung in Scheme 2 page 730 ----	21
A	DE 40 31 798 A (HOECHST AG) 9 April 1992 (1992-04-09) the whole document ----	1-25
P,X	WO 01 87849 A (KANE JOHN L ;QIAO SHUANG (US); VINICK FRED (US); GENZYME CORP (US)) 22 November 2001 (2001-11-22) page 39, line 6 - line 22 -----	25

INTERNATIONAL SEARCH REPORT
Information on patent family members

International Application No.
PCT/EP 02/01403

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)		Publication date
JP 05143796	A	11-06-1993	NONE		
WO 0061586	A	19-10-2000	AU 3816600 A		14-11-2000
			BR 0009558 A		19-02-2002
			CZ 20013605 A3		13-03-2002
			WO 0061586 A1		19-10-2000
			EP 1171443 A1		16-01-2002
			NO 20014824 A		04-10-2001
DE 4031798	A	09-04-1992	DE 4031798 A1		09-04-1992
WO 0187849	A	22-11-2001	AU 5969101 A		26-11-2001
			WO 0187849 A2		22-11-2001

Continuation of box I.2

The search yielded already in the initial phase a very large number of novelty-destroying documents for claim 1. These documents are so numerous that it is impossible to establish for what subject matter protection could be justifiably sought for the totality of the claims. (Art. 6 PCT). For this reason a meaningful search covering the entire scope of protection sought is impossible. The search was therefore restricted to:

The compounds (I) as defined in claim 1, wherein the term "bioisoster" (used in the definition of R) represents the groups (i.e. $-C(=A)-E$ and the structural formulae on page 188) actually indicated in said claim.

The applicant's attention is drawn to the fact that claims, or parts of claims relating to inventions in respect of which no international search report has been established need not be the subject of an international preliminary examination (Rule 66.1(e) PCT). EPO policy, when acting as an International Preliminary Examining Authority, is normally not to carry out a preliminary examination on matter which has not been searched. This is the case, irrespective of whether or not the claims are amended following receipt of the search report (Article 19 PCT) or during any Chapter II procedure whereby the applicant provides new claims.

IPK 7	A01N43/54	A01N43/647	A01N43/653	A01N43/707	A01N43/74
	A01N43/76	A01N43/78	A01N43/80	C07D401/04	C07D401/14
	C07D405/14	C07D409/14	C07D417/14	C07D413/14	

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierte Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 7 A01N C07D

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der Internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, WPI Data, PAJ, CHEM ABS Data

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 017, no. 532 (P-1619), 24. September 1993 (1993-09-24) & JP 05 143796 A (IKUO NAGATA), 11. Juni 1993 (1993-06-11) Zweite Verbindung in der linken Spalte Seite 877	1-8, 12, 13
X	WO 00 61586 A (AKZO NOBEL NV ;ADANG ANTON EGBERT PETER (NL); GERRITSMA GERRILDINA) 19. Oktober 2000 (2000-10-19) Beispiel 16	1-8, 12, 13

 Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen Siehe Anhang Patentfamilie

* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

A Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

E älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem Internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

L Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

O Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Aussstellung oder andere Maßnahmen bezieht

P Veröffentlichung, die vor dem Internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

T Spätere Veröffentlichung, die nach dem Internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

X Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

Y Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

& Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der Internationalen Recherche

Absendedatum des Internationalen Recherchenberichts

2. Mai 2002

08/05/2002

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde
Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Fritz, M

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie ^a	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	SAR ET AL.: "Synthesis, Oxidation and Claisen Rearrangement of 4-(Allyloxy)phenyl-1,4-dihdropyridines and -pyrimidines" ACH MODELS CHEM., Bd. 131, Nr. 3-4, 1994, Seiten 363-376, XP001070105 Verbindung 11h Seite 366 -----	25
X	CORONA DEL L ET AL: "SYNTHESIS AND IN VITRO STUDY OF PLATELET ANTIAGGREGANT ACTIVITY OF 2(4)-IMIDAZOL-1-YL-4(2)-CYCLOALKYLAMINO PYRIMIDINES" EUROPEAN JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY, EDITIONS SCIENTIFIQUE ELSEVIER, PARIS, FR, Bd. 26, 1991, Seiten 729-733, XP002064599 ISSN: 0223-5234 Erste Verbindung in Scheme 2 Seite 730 -----	21
A	DE 40 31 798 A (HOECHST AG) 9. April 1992 (1992-04-09) das ganze Dokument -----	1-25
P,X	WO 01 87849 A (KANE JOHN L ;QIAO SHUANG (US); VINICK FRED (US); GENZYME CORP (US)) 22. November 2001 (2001-11-22) Seite 39, Zeile 6 - Zeile 22 -----	25

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 02/01403

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument		Datum der Veröffentlichung		Mitglied(er) der Patentfamilie		Datum der Veröffentlichung
JP 05143796	A	11-06-1993	KEINE			
WO 0061586	A	19-10-2000	AU BR CZ WO EP NO	3816600 A 0009558 A 20013605 A3 0061586 A1 1171443 A1 20014824 A		14-11-2000 19-02-2002 13-03-2002 19-10-2000 16-01-2002 04-10-2001
DE 4031798	A	09-04-1992	DE	4031798 A1		09-04-1992
WO 0187849	A	22-11-2001	AU WO	5969101 A 0187849 A2		26-11-2001 22-11-2001

WEITERE ANGABEN

PCT/ISA/ 210

Fortsetzung von Feld I.2

Die Recherche ergab in ihrer Anfangsphase eine sehr große Zahl neuheitsschädlicher Verbindungen für Anspruch 1. Diese Zahl ist so groß, daß sich unmöglich feststellen lässt, für was in der Gesamtheit der Patentansprüche eventuell nach zu Recht Schutz begehrzt werden könnte (Art. 6 PCT). Aus diesen Gründen erscheint eine sinnvolle Recherche über den gesamten Bereich der Patentansprüche unmöglich. Die Recherche wurde daher beschränkt auf:

Die Verbindungen (I) wie in Anspruch 1 definiert, bei denen der gewählte Ausdruck "Bioisoster" (verwendet in der Definition von R) nur die in diesem Anspruch tatsächlich darin aufgeführten Gruppierungen (d.h. -C(=A)-E sowie die auf Seite 188 angegebenen Strukturformeln) repräsentiert

Der Anmelder wird darauf hingewiesen, daß Patentansprüche, oder Teile von Patentansprüchen, auf Erfindungen, für die kein internationaler Recherchenbericht erstellt wurde, normalerweise nicht Gegenstand einer internationalen vorläufigen Prüfung sein können (Regel 66.1(e) PCT). In seiner Eigenschaft als mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragte Behörde wird das EPA also in der Regel keine vorläufige Prüfung für Gegenstände durchführen, zu denen keine Recherche vorliegt. Dies gilt auch für den Fall, daß die Patentansprüche nach Erhalt des internationalen Recherchenberichtes geändert wurden (Art. 19 PCT), oder für den Fall, daß der Anmelder im Zuge des Verfahrens gemäß Kapitel II PCT neue Patentansprüche vorlegt.